PCT

国際事務局



特許協力条約に基づいて公開された国際出願

(51) 国際特許分類6

C07D 305/08, 307/22, 309/14, C07H 5/06, 15/18, A61K 31/335, 31/34, 31/35, 31/70

(11) 国際公開番号

WO96/25408

(43) 国際公開日

1996年8月22日(22.08.96)

(21) 国際出願番号

PCT/JP96/00286

(22) 国際出顧日

1996年2月9日(09.02.96)

(30) 優先権データ

特顧平7/25398 特顧平7/25402 1995年2月14日(14.02.95)

1995年2月14日(14.02.95) 1995年9月12日(12.09.95)

特願平7/234236 特願平7/272432

1995年10月20日(20.10.95)

JP JP JP

JР

A1

(71) 出願人 (米国を除くすべての指定国について)

三菱化学株式会社

(MITSUBISHI CHEMICAL CORPORATION)[JP/JP]

〒100 東京都千代田区丸の内二丁目5番2号 Tokyo, (JP)

(72) 発明者;および

(75) 発明者/出願人(米国についてのみ)

安藤亮一(ANDO, Ryoichi)[JP/JP]

增田裕和(MASUDA, Hirokazu)[JP/JP]

稻越直人(INAKOSHI, Naoto)[JP/JP]

直原哲夫(JIKIHARA, Tetsuo)[JP/JP]

藤村義幸(FUJIMURA, Yoshiyuki)[JP/JP]

丹羽卓朗(NIWA, Takuro)[JP/JP] 吉井成彦(YOSHII, Narihiko)[JP/JP] 田畑礼子(TABATA, Reiko)[JP/JP]

斎藤健一(SAITO, Ken-Ichi)[JP/JP]

有友啓一(ARITOMO, Keiichi)[JP/JP]

〒227 神奈川県横浜市青葉区鴨志田町1000番地

三菱化学株式会社 横浜総合研究所内 Kanagawa, (JP)

杉 敏朗(SAKAKI, Toshiro)[JP/JP]

〒100 東京都千代田区丸の内二丁目5番2号

三菱化学株式会社 医薬カンパニー内 Tokyo, (JP)

(74) 代理人

弁理士 長谷川暁司(HASEGAWA, Koji)

〒100 東京都千代田区丸の内二丁目5番2号

三菱化学株式会社内 Tokyo, (JP)

(81) 指定国

CA, CN, JP, KR, US, 欧州特許(AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR,

GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).

添付公開書類

国際調査報告書

(54) Title: OXYGEN-CONTAINING HETEROCYCLIC DERIVATIVES

(54) 発明の名称 含酸素複素環誘導体

(57) Abstract

An oxygen-containing heterocyclic derivative represented by general formula (I), a salt thereof, a solvate thereof or a hydrate thereof: wherein R¹ represents hydrogen, A, B, etc., (wherein R⁸ represents C₁₋₂₀ alkyl, aryl, etc.); R², R⁴ and R⁶ represent each hydrogen, C₁₋₅ alkyl, etc.; R³ and R⁵ represents each hydrogen, C₁₋₂₀ alkyl, etc.; R⁷ represents hydrogen, C, etc. (wherein R⁹ represents C₁₋₁₀ alkyl); A represents C₁₋₃ alkylene; and n is 0 or 1. The derivative, which has a potent inhibitory effect on a cysteine protease and is excellent in oral absorbability, tissue transmigration properties and cell membrane-permeability, is useful as a remedy for apoplexy, Alzheimer's diseases, etc.

(57) 要約

下記一般式(I)で表される含酸素複素環誘導体、その塩、その溶媒和物またはその水和物。

(R⁸:C₁~C₂₀のアルキル基、アリール基等)

R²、R⁴、R⁶:水素原子、C₁~C₅のアルキル基等

R³、R⁵:水素原子、C₁~C₂₀のアルキル基等

R':水素原子、R°-C-等

(R°:C₁~C₁₀のアルキル基)

A:C:~C:のアルキレン基

n: 0 または 1

本発明の含酸素複素環誘導体はシステインプロテアーゼに対して強い阻 害作用を示し、また経口吸収性、組織移行性、細胞膜透過性にもすぐれて おり、脳卒中、アルツハイマー病等の治療薬として有用である。

情報としての用途のみ PCTに基づいて公開される国際出願をパンフレット第一頁にPCT加盟国を同定するために使用されるコード

明 細 書

含酸素複素環誘導体

5 技術分野

15

20

この発明は新規な含酸素複素環誘導体に関する。

背景技術

パパイン、カテプシンB、カテプシンH、カテプシンL、カルパイン、 10 インターロイキン1 β変換酵素等のシステインプロテアーゼの生体内での 働きが解明されるに従い、その異常亢進が種々の疾病の原因であることが 判明してきており、またシステインプロテアーゼ阻害剤がそれらの疾患の 動物モデルで有効であったという報告が増えつつある。

筋ジストロフィー、筋萎縮症などの筋疾患で見られる骨格筋崩壊において、カルパインやカテプシンBなどのシステインプロテアーゼは、筋繊維蛋白質の分解を通じて乙線の消失などの初期過程に関与していると考えられている(代謝、25巻、臨時増刊号「代謝病ハイライト」、183ページ、1988年)。また、システインプロテアーゼ阻害剤であるE-64ー dは、筋ジストロフィー症ハムスターにおいて延命効果があったと報告されている(Journal of Pharmacobio Dynamics,10巻、678ページ、1987年)。したがって、システインプロテアーゼ阻害剤は筋ジストロフィー、筋萎縮症等の治療薬になると考えられる。

心筋梗塞や脳卒中等の虚血性疾患において、虚血後の細胞障害の主な原 25 因は、キサンチン酸化酵素が産生する活性酵素である。虚血の過程で上昇 したCa²⁺濃度によって活性化されたカルパインがキサンチン酸化酵素の

10

15

20

25

前駆体であるキサンチン脱水素酵素を限定分解して酸化酵素に変換しているという説がある(New England Journal of Medicine, 312巻、159ページ、1985年)。また、カルパインの活性化が心筋細胞死や脳神経細胞死の直接的な原因にもなりうると考えられている(最新医学、43巻、783ページ、1988年)。カルパインの阻害剤であるNCO-700が心筋梗塞の動物モデルで効果があることが報告されており(Arzneimittel Forschung/Drug Research, 36巻、190ページ、671ページ、1986年)、またE-64-cは脳虚血後の微小管結合蛋白の分解を抑制している(Brain Research, 526巻、177ページ、1990年)。したがって、カルパインの阻害剤は心筋梗塞や脳卒中などの虚血性疾患の治療薬になると考えられる。

アルツハイマー病患者の脳に特有に見られる老人斑にはアミロイドという蛋白が沈着しているが、このアミロイドはアミロイド蛋白前駆体(APP)の分解により生成することが知られている。APPの正常代謝ではアミロイドは生成しないが、異常亢進したプロテアーゼによる異常代謝によりアミロイドが生成し、これが老人斑になると考えられている(Scientific American,1991年11月号、40ページ)。したがって、プロテアーゼの阻害剤は、アルツハイマー病の治療薬になると期待されている。

うさぎの頭部外傷モデルにおいて、カルパインが活性化されていることが報告されており(Neurochemical Research、16巻、483ページ、1991年)、またラットの頭部外傷モデルにおいて、カルパイン阻害剤であるロイペプチンを投与することにより、軸策の保護作用が観察されている(Journal of Neurosurgery、65巻、92ページ、1986年)。したがって、カルパインの

10

15

20

25

阻害剤は頭部外傷において意識障害改善や運動障害改善等の効果があると 考えられる。

神経細胞の樹状突起に存在するミエリン結合蛋白がカルパインにより分解されるという報告がある(Journal of Neurochemistry, 47巻、1007ページ、1986年)。したがって、カルパインの阻害剤が神経細胞の脱髄によって起こるといわれる疾患、例えば多発性硬化症や末梢神経のニューロパシーに対して効果があると考えられる。

白内障のうちの多くのものは、水晶体中の水溶性蛋白であるクリスタリンがプロテアーゼの働きにより加水分解されるために水晶体の白濁が生じると言われている。実験モデルでの白内障およびヒトのある種の白内障では、水晶体内のカルシウム濃度が上昇しており(Investigative Ophthalmology & Visual Science. 28巻、1702ページ、1987年、Experimental Eye Research, 34巻、413ページ、1982年)、また水晶体中に含まれるプロテアーゼのうち最も多いのはカルパインであることから(Lens and Eye Toxicity Research, 6巻、725ページ、1989年)、カルパインの異常亢進が白内障の原因の一つであると考えられている。カルパインの阻害剤であるE-64が白内障の実験モデルで効果があったという報告(Investigative Ophthalmology & Visual Science, 32巻、533ページ、1991年)もあることから、カルパインの阻害剤は白内障の治療薬になると考えられる。

炎症とのかかわりあいが深い好中球は、走行化因子やホルボールエステルによる刺激に対して脱顆粒やスーパーオキシドの産生で応答することが知られており、これはプロテインキナーゼC(PKC)によって媒介され

10

15

20

25

ていると考えられている。カルパインはこのPKCを活性化する働きをしており、脱顆粒には促進的に、スーパーオキシド産生には抑制的に作用しているという報告がある(Journal of Biological Chemistry, 263巻、1915ページ、1988年)。また、ラットのマクロファージにおけるカテプシンBの濃度が、白血球や好中球の場合よりも30~40倍高く、しかも炎症マクロファージの酵素濃度の方が普通のマクロファージより6倍高いと報告されている(Journa of Biochemistry, 98巻、87ページ、1985年)。さらに最近、プレインターロイキン18をインターロイキン18に変換する酵素(インターロイキン18変換酵素)がシステインプロテアーゼであることが判明し(Nature, 356巻、768ページ、1992年)、

炎症の発現にシステインプロテアーゼの活性化が重要な働きをしているこ

とが明らかになった。これらのことから、システインプロテアーゼの阻害

剤は、抗炎症剤として用いることができると考えられる。

I型アレルギー反応は、生体が抗原に感作されることにより産生した免疫グロブリンE(IgE)を介して進行する。システインプロテアーゼ阻害剤であるエスタチンAはIgEの産生を特異的に抑制し、IgGの産生には影響を与えないと報告されている(The Journal of Antibiotics, 42巻、1362ページ、1989年)。したがって、システインプロテアーゼ阻害剤は、抗アレルギー剤として用いることができると考えられる。

肝細胞が壊死する場合には、細胞膜の障害により C a ²+の透過性が増して細胞内の C a ²+濃度が高まってカルパインが活性化されるために、その基質である骨格蛋白等の分解が起きて細胞死にいたると考えられている。したがって、カルパインの阻害剤は劇症肝炎の治療薬として用いることができる。

20

25

カテプシンB、カテプシンL等のカテプシン類は、破骨細胞内での骨コラーゲンの分解に関与している。副甲状腺ホルモンを投与して骨破壊を亢進させたラットに、カテプシン類の阻害剤であるE-64、あるいはエスタチンAを投与すると、血中カルシウム濃度およびヒドロキシプロリン濃度が低下することが報告されている(Biochemical and Biophysical Research Communication, 125巻、441ページ、1984年、特開平2-218610号公報)。したがって、カテプシン類の阻害剤は骨粗鬆症や高カルシウム血症の治療薬になると考えられる。

10 カルパインの基質として、エストロゲン受容体やアンドロゲン受容体等の性ホルモン受容体がある。カルパインはこれらの受容体を活性化させることが知られており、カルパインの異常亢進は性ホルモン受容体の異常活性化によると考えられる疾患、例えば乳癌、前立腺癌、前立腺肥大等をひきおこすと言われている。したがって、カルパインの阻害剤は上記の疾患の治療薬になると考えられる。

細胞の癌化に伴い、表皮増殖因子(EGF)受容体が活性化すると言われており、カルパインはEGF受容体を基質としてこれを活性化することが知られている。また、成人T細胞性ヒト白血病ウィルス(ATLV/HTLV-1)に感染した細胞において、カルパインが活性化されていたとの報告がある(生化学、57巻、1202ページ、1985年)。一方、カテプシンBが癌の転移の重要な段階であるコラーゲン分解を促進したり、あるいは直接コラーゲンを分解することや、新生物細胞の原形質膜と関係が深いことなどから、癌の転移のプロセスに大きく関与していると言われている。(Tumor Progression and Markers,47ページ、1982年、Journal of Biological Chemistry,256巻、8536ページ、1984年)。

10

15

20

25

これらのことから、システインプロテアーゼの阻害剤は、癌の増殖抑制、 転移予防に効果があると考えられる。

血小板が活性化されると凝集を起こし、血栓の原因となる。カルパインの阻害剤であるE-64-dが、トロンビンで惹起される血小板凝集を抑制したとの報告がある(Thrombosis Research, 57 巻、847ページ、1990年)。したがって、カルパインの阻害剤は血小板凝集抑制剤として用いることができる。

以上述べてきたように、システインプロテアーゼの異常亢進は種々の疾患の原因となり、またいくつかのシステインプロテアーゼ阻害剤は動物モデルなどで有効だと報告されている。

しかしながら既知の阻害剤は、E-64(Agricaltural and Biological Chemistry, 42巻、529ペ ージ、1978年)、E-64-d (Journal of Bioch emistry, 93巻、1305ページ、1983年)、NCO-70 0 (特開昭 5 8 - 1 2 6 8 7 9 号公報)、エスタチンA、B (The J ournal of Antibiotics, 42巻、1362ページ、 1989年)等のエポキシコハク酸誘導体あるいはペプチドのクロロメチ ルケトン(Journal of Biochemistry, 99巻、 173ページ、1986年) やアシルオキシメチルケトン (Bioche mistry, 30巻、4678ページ、1991年) に代表されるペプ チドのα-置換ケトンなど、不可逆阻害剤がほとんどである。一般に不可 逆阻害剤は標的酵素以外の生体構成成分と非特異的に反応しやすいために 毒性が強いと言われており、臨床で用いられた化合物は少ない。また、可 逆阻害剤としてはロイペプチン (The Journal of Ant i b i o t i c s, 2 2巻、2 8 3ページ、1 9 6 9年)、カルペプチン (Journal of Enzyme Inhibition, 3巻、

195ページ、1990年)等のペプチジルアルデヒドが知られているが、 化学的な安定性、生体内での安定性、細胞膜の透過性などに問題があると 言われている。

5 発明の開示

そこで本発明者らは、経口吸収性、組織移行性、細胞膜透過性などに優れたシステインプロテアーゼの阻害剤について研究を進めた結果、本発明を完成するに至った。

すなわち、本発明の要旨は下記一般式(I)

10

C。 ~ C。のシクロアルキルオキシ基、フルオレニル基、C₁ ~ C。のア ルコキシ基、置換基を有していてもよいC。 ~ C₁₄のアリール基、置換基を有していてもよいC。 ~ C₁₄のアリール基、置換基を有していてもよいC。 ~ C₁₄のアリールチオ基、置換基を有していてもよいC。 ~ C₁₄のアリールスルホニル基および置換基を有していてもよい複素環残基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₁ ~ C₂₀のアルキル基;C₂ ~ C。のシクロアルキル基;置換基を有していてもよいC。 ~ C₁₄のアリール基

20

25

で置換されていてもよい $C_2 \sim C_5$ のアルケニル基;または置換基を有していてもよい複素環残基を表す)を表し、 R^2 、 R^4 および R^6 はそれぞれ独立して水素原子、 $C_1 \sim C_5$ のアルキル基または $C_2 \sim C_6$ のアルカノイル基を表し、 R^3 および R^5 はそれぞれ独立して水素原子;置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基、水酸基、 $C_1 \sim C_5$ のアルコキシ基、 $C_1 \sim C_5$ のアルキルチオ基および $C_7 \sim C_{12}$ のアラルキルオキシ基からなる群より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基;または置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基

を表し、 R^7 は水素原子、 $C_1 \sim C_8$ のアルキル基または $R^8 - C - (R^8 \text{ d} C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基または置換基を有していてもよい $C_8 \sim C_{12}$ のアリール基を表す)を表し、 $A \text{ d} C_1 \sim C_3$ のアルキル基を有していてもよい $C_1 \sim C_3$ のアルキレン基を表し、n d 0 または1 を表す)で表される含酸素複素環誘導体、薬学的に許容されるその塩、またはその溶塊もしくは水和物に存する。

以下、本発明について詳細に説明する。

上記一般式(I)において、R®で定義されるC1~C20のアルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソプチル基、secーブチル基、tertーブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、tertーペンチル基、ヘキシル基、イソヘキシル基、ヘプチル基、オクチル基、ノニル基、デシル基、ウンデシル基、ドデシル基、トリデシル基、テトラデシル基、ペンタデシル基、オクタデシル基等が挙げられ、かかるアルキル基は、シクロプロピル基、シクロブチル基、シクロペンチル基、シクロヘナシル基、シクロヘブチル基、シクロオクチル基等のC3~C8のシクロアルキル基;シクロプロピルオキシ基、シクロプチルオキシ基、シクロペンチルオキシ基、シクロヘキシ

ルオキシ基、シクロヘプチルオキシ基、シクロオクチルオキシ基等のC。 ~C.のシクロアルキルオキシ基:フルオレニル基:メトキシ基、エトキ シ基、プロポキシ基、イソプロポキシ基、プトキシ基、イソプトキシ基、 tert-ブトキシ基、ペンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基等のC₁ ~ C s のアルコキシ基;フェニル基、ナフチル基、アントリル基等の C s 5 ~Cuのアリール基:フェノキシ基、ナフトキシ基等のC。~Cuのアリ ールオキシ基:フェニルチオ基、ナフチルチオ基等のC。~C」4のアリー ルチオ基:フェニルスルホニル基、ナフチルスルホニル基等のC。~C14 のアリールスルホニル基:およびフラン環、ジヒドロフラン環、テトラヒ ドロフラン環、ピラン環、ジヒドロピラン環、テトラヒドロピラン環、ベ 10 ンゾフラン環、イソベンゾフラン環、クロメン環、クロマン環、イソクロ マン環、チオフェン環、ベンゾチオフェン環、ピロール環、ピロリン環、 ピロリジン環、イミダゾール環、イミダブリン環、イミダブリジン環、ピ ラゾール環、ピラゾリン環、ピラゾリジン環、トリアゾール環、テトラゾ ール環、ピリジン環、ピリジンオキシド環、ピペリジン環、ピラジン環、 15 ピペラジン環、ピリミジン環、ピリダジン環、インドリジン環、インドー ル環、インドリン環、イソインドール環、イソインドリン環、インダゾー ル環、ベンゾイミダゾール環、プリン環、キノリジン環、キノリン環、フ タラジン環、ナフチリジン環、キノキサリン環、キナゾリン環、シンノリ ン環、プテリジン環、オキサゾール環、オキサゾリジン環、イソキサゾー 20 ル環、イソキサゾリジン環、チアゾール環、チアジリジン環、イソチアゾ ール環、イソチアゾリジン環、ジオキサン環、ジチアン環、モルホリン環、 チオモルホリン環等の酸素原子、硫黄原子、窒素原子から選ばれるヘテロ 原子を1~4個有し、環を構成する総原子数が5~10の複素環残基から なる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。R®で定義され 25 るC。~C。のシクロアルキル基およびC。~C:4のアリール基としては、

15

20

上記の $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基の置換基として挙げたのと同様の基が挙げられる。 $C_2 \sim C_5$ のアルケニル基としては、ビニル基、1-プロペニル基、2-プロペニル基、1-プテニル基、1-ペンテニル基等が挙げられ、かかるプロペニル基は上記の $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基の置換基として挙げたのと同様の $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基で置換されていてもよい。複素環残基としては、 $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基の置換基として挙げたのと同様の基が挙げられる。

R²、R⁴ およびR⁶ で定義されるC₁ ~ C₅ のアルキル基としては、 それぞれ独立してメチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、プ 10 チル基、イソプチル基、ペンチル基、イソペンチル基等が挙げられ、C₂ ~ C₅ のアルカノイル基としては、アセチル基、プロピオニル基、プチリ ル基、バレリル基等が挙げられる。

 R^s および R^s で定義される $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基としては、それぞれ独立して R^s で定義したのと同様の基が挙げられ、かかるアルキル基は、 R^s で定義したのと同様の $C_s \sim C_{14}$ のアリール基;水酸基; R^s で定義したのと同様の $C_1 \sim C_s$ のアルコキシ基;メチルチオ基、エチルチオ基、プロピルチオ基、イソプロピルチオ基、ブチルチオ基、イソプチルチオ基、インプチルチオ基、インプチルチオ基、ナフチルチオ基;およびベンジルオキシ基、フェニルメトキシ基、ナフチルメトキシ基等の $C_1 \sim C_s$ のアルキルチオ基;およびベンジルオキシ基、フェニルメトキシ基、ナフチルメトキシ基等の $C_7 \sim C_{12}$ のアラルキルオキシ基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。 $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基としては、上記で定義したのと同様の基が挙げられる。

R⁷で定義されるC₁~C₅のアルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、プチル基、イソプチル基、sec - ブチル基、tert-プチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、tert-ペンチル基が挙げられる。

10

15

20

25

 R^8 で定義される $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基としては、メチル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル基、sec - ブチル基、t er t - ブチル基、ペンチル基、イソペンチル基、ネオペンチル基、t er t - ペンチル基、ヘキシル基、イソヘキシル基、ヘプチル基、オクチル基、ノニル基、デシル基等が挙げられ、 $C_6 \sim C_{12}$ のアリール基としては、フェニル基、ナフチル基等が挙げられる。

Aで定義されるC」〜C。のアルキレン基としては、メチレン基、エチレン基、プロピレン基が挙げられ、かかるアルキレン基は、メチル基、エチル基、プロピル基等のC」〜C。のアルキル基を1〜2個有していてもよい。

さらに上記の定義中、各置換基の端部に位置するアリール基および複素 環残基は、さらにフッ素原子、塩素原子、臭素原子等のハロゲン原子;メ チル基、エチル基、プロピル基、イソプロピル基、ブチル基、イソブチル 基、sec-ブチル基、tert-ブチル基、ペンチル基、イソペンチル 基、ネオペンチル基、tert-ペンチル基等のC;~C;のアルキル基 : トリフルオロメチル基: メトキシ基、エトキシ基、プロポキシ基、イソ プロポキシ基、ブトキシ基、イソプトキシ基、tert-ブトキシ基、ペ ンチルオキシ基、イソペンチルオキシ基等のC1~C5のアルコキシ基; メチレンジオキシ基、エチレンジオキシ基、プロピレンジオキシ基等のC; ~ C 。 のアルキレンジオキシ基 ; 水酸基 ; ニトロ基 ; アセトキシ基、プロ ピオニルオキシ基、ブチリルオキシ基、バレリルオキシ基等のC2~C6 のアルキルカルボニルオキシ基;カルボキシル基;メトキシカルボニル基、 エトキシカルボニル基、プロポキシカルボニル基、イソプロポキシカルボ ニル基、プトキシカルボニル基、イソプトキシカルボニル基、tert-ブトキシカルボニル基、ペンチルオキシカルボニル基等の℃₂~℃。のア ルコキシカルボニル基:オキソ基:アセチル基、プロピオニル基、プチリ

ル基、バレリル基等のC2~C。のアルキルカルボニル基;アミノ基、メチルアミノ基、エチルアミノ基、プロピルアミノ基、イソプロピルアミノ基、ベンチルアミノ基、イソプチルアミノ基等のC1~C。のモノアルキルマミノ基;ジメチルアミノ基、エチルメチルアミノ基、ジエチルアミノ基、メチルプロピルアミノ基、ジイソプロピルアミノ基等のC2~C10のジアルキルアミノ基;アセチルアミノ基、プロピオニルアミノ基、イソプロピオニルアミノ基、ブチリルアミノ基、バレリルアミノ基等のC2~C。のアルキルカルボニルアミノ基:カルバモイル基;メチルカルバモイル基、エチルカルバモイル基、プロピルカルバモイル基、ブチルカルバモイル基、サーブチルカルバモイル基、プチルカルバモイル基、インチルカルバモイル基、インチルカルバモイル基、インチルカルバモイル基、インチルカルバモイル基、インチルカルバモイル基、インチルカルバモイル基をのC2~C。のアルキルカルバモイル基およびフェニル基、ナフチル基等のC。~C12のアリール基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよい。

15 本願発明のうち、好ましい化合物としては R^1 が水素原子、 $R^8 - \overset{!'}{C} - \overset{!'}{\sim}$

$$R^* - O - C - C - C - R^* - N - C - \sharp t t R^* - S - (R^* t C_3 \sim C_8)$$

20 のアリール基、置換基を有していてもよいC。~C14 のアリール基、置換基を有していてもよいC。~C14のアリールオキシ基、置換基を有していてもよいC。~C14のアリールチオ基、置換基を有していてもよいC。~C14のアリールスルホニル基および置換基を有していてもよい複素環残基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC1~C20のアルキル基:C3~C。のシクロアルキル基:置換基を有していてもよいC1~C20のアルキル基:で3~C。のシクロアルキル基:置換基を有していてもよいC。~C14のアリール基:置換基を有していてもよいC。~C14のアリール基:

10

25

または置換基を有していてもよい復素環残基を表す)を表し、 R^2 、 R^4 および R^6 がそれぞれ独立して水素原子、 $C_1 \sim C_5$ のアルキル基または $C_2 \sim C_6$ のアルカノイル基を表し、 R^3 および R^5 がそれぞれ独立して水素原子;または置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基および $C_1 \sim C_5$ のアルコキシ基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基を表し、 R^7 が水素原子、 $C_1 \sim C_{20}$

 C_s のアルキル基または R^s $-C-(R^s$ は C_1 $\sim C_{10}$ のアルキル基または置換基を有していてもよい C_s $\sim C_{12}$ のアリール基を表す)を表し、A が C_1 $\sim C_s$ のアルキル基を有していてもよい C_1 $\sim C_s$ のアルキレン基を表し、n が 0 または 1 を表す化合物が挙げられる。これらの化合物のうち、 R^2 、 R^4 および R^6 がそれぞれ独立して水素原子または C_1 $\sim C_s$ のアルキル基を表す化合物がより好ましく、n が 0 を表す化合物がさらに好ましい。特に好ましい化合物としては、

○ (1) R₁ がR⁸ - C - (R⁸ は置換基を有していてもよいC₆ ~ C₁4 のアリール基、置換基を有していてもよいC₆ ~ C₁4のアリールオキシ基、置換基を有していてもよいC₆ ~ C₁4のアリールチオ基および置換基を有していてもよいC₆ ~ C₁4のアリールメルホニル基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₁ ~ C₂₀のアルキル基;置換基を有していてもよいC₀ ~ C₁₄のアリール基;置換基を有していてもよいC₀ ~ C₁₄のアリール基で置換されていてもよいC₂ ~ C₅ のアルケニル基;または置換基を有していてもよい複素環残基を表す)を表し、R² 、R⁴ およびR⁶ が水素原子を表し、R³ およびR⁵ がそれぞれ独立してC₁ ~

 $\sim C_{10}$ のアルキル基を表す)を表し、Aが C_{1} $\sim C_{3}$ のアルキレン基を表し、n が 0 を表す化合物、

○□ (2) R₁ がR³ - O - C - (R³ はC₃ ~ C₃ のシクロアルキル基、
フルオレニル基、置換基を有していてもよいC₃ ~ C₁₄のアリール基およ
び置換基を有していてもよい複素環残基からなる群より選ばれる1以上の
置換基を有していてもよいC₁ ~ C₂₀のアルキル基:C₃ ~ C₃ のシクロ
アルキル基:または置換基を有していてもよいC₅ ~ C₁₄のアリール基を
表す)を表し、R² 、R⁴ およびR⁵ が水素原子を表し、R³ およびR⁵
がそれぞれ独立して水素原子:または置換基を有していてもよいC₅ ~ C₁₄
のアリール基およびC₁ ~ C₅ のアルコキシ基からなる群より選ばれる1
以上の置換基を有していてもよいC₁ ~ C₂₀のアルキル基を表し、R¹ が

) | 水素原子またはR°-C-(R°はC₁~C₁₀のアルキル基を表す)を表 し、AがC₁~C。のアルキレン基を表し、nが0を表す化合物、

(3) R₁ がR⁶ -N-C-(R⁶ は置換基を有していてもよいC₆ ~ C₁₄のアリール基を表す)を表し、R² 、R⁴ およびR⁶ が水素原子を表し、R³ およびR⁵ がそれぞれ独立してC₁ ~ C₂₀のアルキル基を表し、

O | R'が水素原子またはR°-C-(R°はC₁~C₁₀のアルキル基または | 置換基を有していてもよいC₆~C₁₂のアリール基を表す)を表し、Aが | C₁~C₃のアルキレン基を表し、nが0を表す化合物、および

のアリール基または置換基を有していてもよい複素環残基を表す)を表し、 R^2 、 R^4 および R^6 が水素原子を表し、 R^3 および R^5 がそれぞれ独立して $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基を表し、 R^7 が水素原子、 $C_1 \sim C_5$ のアル

- 当 5 キル基またはR°-C-(R°はC₁~C₁₀のアルキル基または置換基を 有していてもよいC。~C₁₂のアリール基を表す)を表し、AがC₁~C₃ のアルキル基を有していてもよいC₁~C₃のアルキレン基を表し、nが 0を表す化合物が挙げられる。
- 上記(1)の化合物のうち、 R^1 が R^8 C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C C -
- 15 それぞれ独立して $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基を表し、 R^7 が $R^8 C (R^8$ は $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基を表す)を表し、Aが $C_1 \sim C_8$ のアルキレン 基を表し、n が 0 を表す化合物がより好ましい。
- 上記(2)の化合物のうち、 R_1 が $R^8 O C (R^8$ はフルオレニ ル基および置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基からなる群 より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基 または $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキル基を表す)を表し、 R^2 、 R^4 および R^6 が水素原子を表し、 R^3 および R^5 がそれぞれ独立して $C_1 \sim C_{20}$ の
- □ 25 アルキル基を表し、R⁷がR⁸ C (R⁸はC₁ ~ C₁₀のアルキル基を表す)を表し、AがC₁ ~ C₃のアルキレン基を表し、nが0を表す化合

15

20

25

物がより好ましい。

上記(3)の化合物のうち、R⁷が水素原子を表す化合物がより好ましい。

いてもよいC。~C14のアリール基を表す)を表し、R⁷がC1~C5のア

ルキル基を表す化合物、およびR¹ かR°-S-(R° は置換基を有して

いてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基を表す)を表し、 R^7 が $R^8 - C - (R^8$ は置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{12}$ のアリール基を表す)を表す化合物がより好ましい。

上記一般式(I)で表される本発明の含酸素複素環誘導体は、薬学的に許容される塩を形成することができる。かかる塩の具体例としては、酸性基が存在する場合には、リチウム塩、ナトリウム塩、カリウム塩、マグネシウム塩、カルシウム塩等の金属塩、またはアンモニウム塩、メチルアンモニウム塩、ジメチルアンモニウム塩、トリメチルアンモニウム塩、ジシクロヘキシルアンモニウム塩等のアンモニウム塩を形成することができ、塩基性基が存在する場合には塩酸塩、臭酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩等の鉱酸塩、あるいはメタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、バラトルエンスルホン酸塩、酢酸塩、プロピオン酸塩、酒石酸塩、フマール酸塩、マレイン酸塩、リンゴ酸塩、シュウ酸塩、コハク酸塩、クエン酸塩、安息香酸塩、マンデル酸塩、ケイ皮酸塩、乳酸塩等の有機酸塩を形成することができる。また、上記一般式(I)で表される本発明の含酸素複素環

誘導体は、溶媒和物もしくは水和物として存在することもできる。

上記一般式(I)で表される本発明の含酸素複素環誘導体に存在する不 斉炭素の立体化学については、それぞれ独立して(R)体、(S)体、あ るいは(RS)体をとることができる。

上記一般式(I)で表される本発明の含酸素複素環誘導体において、R⁷が水素原子の場合の下記一般式(II)(式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、Aおよびnはすでに定義した通りである。)の化学物は、特に溶液中では下記一般式(III)(式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、Aおよびnはすでに定義した通りである。)で表されるヒドロキシアルデヒド誘導体との平衡が存在する。このことは、次の実験結果により説明できる。NMRの測定結果は下記一般式(II)の構造を支持しているが、使用する溶媒の種類によって、下記一般式(II)のラクトール環上の水酸基が結合した炭素原子の立体化学の比率が違うことが、化合物(II)の立体異性体の比率の違いとして観察されている。この異性体の比率の違いは、下記の平衡が存在するために生じると考えられる。

25

20

上記一般式 (I) で表される本発明の含酸素複素環誘導体の具体的な例 としては、n=0 で R^7 が水素原子の場合は下記表-1 に示す化合物が、 n=0 で R^7 が水素原子ではない場合は下記表-2 に示す化合物が、n=1 で R^7 が水素原子の場合は下記表-3 に示す化合物が、n=1 で R^7 が水素原子ではない場合は下記表-4 に示す化合物が挙げられる。

	表 -	1	(n =	0 0	の場	合
--	-----	---	------	-----	----	---

化合物 番 号	R 1	R 4	R ⁵	R 6	OH OH
1		-Н	-Н	-Н	OH OH
2		-Н	-СН ₃	-Н	OH OH
3		-Н	-сн ₂ сн ₂ сн ₃	-Н	OH OH
4		-Н	-CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
5		-н	-сн ₂ сн ₂ сн ₂ сн ₃	-Н	OH
6	н-	-н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
7	H ₃ C 0 1	-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-Н	OH OH

表 -	1	(つづき)
-----	---	-------

	2	`	1 (220)		
化合物 番号	R 1	R 4	R ⁵	Re	OH OH
8		-н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
9		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
10		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
11		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
12	0 - - - -	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
13		-н	-CH ₂ -	-Н	ОН
14		-н	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-н	OH OH

#	•	()	٠,	æ	`
耒	 	-	$\boldsymbol{\neg}$	*)

		<u> </u>	1 (220)		
化合物 番 号	R 1	R ⁴	R ⁵	R6	OH OH
15		-Н	-СН ₂ ОН	-Н	OH OH
16		-н		-Н	OH OH
17		-Н	-н	-Н	OH OH
18		-н	-СН ₃	-н	OH OH
19		-н	-CH ₂ CH ₃	-Н	OH OH
20		-н	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-н	OH OH
21		-Н	-CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH

夷	_	1	()	づ	놐)
77		1		_	=	,

	40	•	1 (226)		
化合物 番 号	R 1	R 4	R ⁵	R6	OH OH
22		-H	-сн ₂ сн ₂ сн ₂ сн ₃	-Н	OH
23		-Н	-CH <ch<sub>3 CH₂CH₃</ch<sub>	-Н	OH OH
24	Н-	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
25	H ₃ C 0 1	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
26	H ₃ C \ 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
27	H ₃ C H ₃ C 0	-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-Н	OH OH
28	H ₃ C 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH

夷	_	1 ((つ	づ	去)

化合物 番 号	R 1	R 4	_R 5	R6	OH OH
29		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
30		-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
31		-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
32		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
33		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₃	OH OH
34		-CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН3	OH OH
35		-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH

· ·	表	į –	1 (つづき)		
化合物 番 号	R ¹	R 4	R ⁵	R e	OH OH
36	F 0 0	-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-H	OH
37	F O O	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-H	OH OH
38	CI	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
39	C1 O	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
40	CI	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
41	Br 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
42	Br O O	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	OH OH

表	 1 (つ	づ	去)

	3	X –	1 ())2)		
化合物 番 号	R I	R 4	R 5	R6	OH OH
43	Br O O	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
44	CH ₃	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH
45	H ₃ C 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	√OH OH
46	H ₃ C 0 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
47	OCH ₃	-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-Н	OH OH
48	CH30 0	-н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
49	CH30 0	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	OH OH

丰	 1 ((つ	づ	去)
277		_	_	_	,

化合物 番 号	R 1	R 4	R 5	R ⁶	OH OH
50		-н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
51		-н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
52		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
53		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
54		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
55		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
56	N O O	-н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH

	•		•		
	ā	長 —	1 (つづき)		
化合物 番 号	RI	R 4	R ⁵	R ⁶	OH OH
57		-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
58		-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	OH OH
59		-н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-Н	OH OH
60	0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
61		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
62	H	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	OH OH
63	H N N	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH

====		1 /	(つ	べ	ᆂ	١
70	_	, ,		٠,	_	,

化合物 番 号	R t	R ⁴	R5	R 6	OH OH
64	H ₃ C \	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-H	OH OH
65	H ₃ C 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
66	H ₃ C ~~~	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	OH OH
67	H ₃ C H ₃ C	-н	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-Н	OH OH
68	H3C 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
69	H ₃ C 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
70	H ₃ C H ₃ C H ₃ C H ₃ C	-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-н	OH OH

	 ā	長 —	1 (つづき)	-	
化合物 番 号	R I	R ⁴	R5	R6	OH OH
71	H ₃ C 0	-н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
72	H ₃ C	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
73	H ₃ C H ₃ C 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
74	CH ₃ (CH ₂) ₅	-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-н	OH OH
75	CH3(CH2)6	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
76	CH3(CH2)8	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
77	CH3(CH2)10	-н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-Н	OH OH

表	_	1	()	つき	<i>)</i>

化合物					(A)
番号	R 1	R 4	R ⁵	R ₆	OH OH
78	CH ₃ (CH ₂) ₁₂	-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-н	OH
79	CH3(CH2)14	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
80		-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
81		-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-Н	OH OH
82		-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
83		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
84		-н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	OH OH

表	_	1	(つづき)

	a	~	1 (226)		
化合物 番号	R 1	R 4	R ⁵	Re	OH OH
85		-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
86		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
87	H3C 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
88	H ₃ C H ₃ C H ₃ C 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
89		-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
90		-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-Н	OH OH
91	F	-н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-Н	OH OH

ÓН

	妻	₹ -	1 (つづき)		
化合物 番 号	R 1	R4	R5	R6	OH OH
92	FOO	-н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-н	OH OH
93	FOO	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
94	CI	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
95	c1 0	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
96	C1 O	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH
97	OCH ₃	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
98	CH O O	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	

CH30

表 - 1 (つづき)

			. (*****,		
化合物 番 号	R-1	R ⁴	R 5	R ⁶	A O OH
99	CH30 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
100	CH ₃ O OCH ₃ O	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
101	CH ₃	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
102	H ₃ C 0 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
103	H ₃ C 0 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
104	CF ₃ 0 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
105	F ₃ C O	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH

表	_	1	(つづき)
44		•	\ -

	4	`	1 (226)		
化合物 番 号	R 1	R 4	R 5	R6	OH OH
106	F ₃ C 0 0	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
107		-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
108		-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
109		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
110	O _s ~	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
111		-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH
112		-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH

	ā	長 一	1 (つづき)		
化合物 番 号	R ¹	R 4	R ⁵	R6	OH OH
113	F	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
114	F	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
115	F	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	OH OH
116	F	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
117	F	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
118	F O	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
119	CIO	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH

-4-			<i>,</i> _	_	J.	`
麦	_	1 (つ	つ	₹)

化合物 番 号	R 1	R 4	R 5	R6	OH OH
120	cı	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	OH OH
121	CI	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
122	Br 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
123	Br 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
124	Br 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
125	CH ₃ 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
126	H ₃ C 0	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-H	OH OH

夷	_	1	(つ	づ	去)

	*		•		
化合物 番 号	R ¹	R4	R 5	Re	OH OH
127	H ₃ C 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
128	H ₃ C CH ₃ O	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
129	CH ₃ O	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
130	H ₃ C O	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
131	H ₃ C CH ₃ CCH ₃	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
132	H ₃ C 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
133	H ₃ C 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH

	表	ŧ -	1 (つづき)		
化合物 番 号	R 1	R 4	R ⁵	R 6	OH OH
134	H ₃ C 0	-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-H	OH OH
135	CF ₃ O	-Н	-сн ₂ сн (сн ₃) ₂	-Н	OH OH
136	F ₃ C 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
137	F ₃ C 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	- <u>H</u>	OH OH
138	CH ₃ 0 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
139	CH30 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
140	CH30 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH

表		1	(つづき)
77	_	1	(つつさ)

	·				·
化合物 番 号	R 1	R4	R5	R6	OH OH
141	CH30 0	-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-н	OH OH
142	CH ₃ O O	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	OH OH
143	CH30 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
144	CH30 OCH3	-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-Н	OH OH
145	CH30 OCH3	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	OH OH
146	H ₃ C 0 0	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	OH OH
147	H ₃ C~0	-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-н	OH

表 - 1 (つづき)

化合物 番号	R 1	R 4	R5	R6	OH OH
148	H ₃ C 0	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	OH
149	H ₃ C 0 0 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	OH OH
150	HO O	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
151	0 0 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
152		-н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-н	OH OH
153	HO 00	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
154	H0 0 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH

麦	_	1	()	づき)
27	_			J 74 J

		×	1 ())		
化合物 番 号	R 1	R4	R 5	R 6	OH OH
155	НО	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
156		-н	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-н	OH OH
157		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	HO OH
158		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
159		-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-Н	OH OH
160		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
161		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH

			,		٠.	
夷	_	1 (つ	つ	2)

	•		1 (226)		
化合物 番 号	R 1	R 4	R 5	R6	OH OH
162		-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	OH
163	S	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
164	S O	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
165	N H O	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
166	H	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
167	CH ₃	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
168	CH ₃	-н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	OH OH
1	·	1			

主		 つ	ー	٠ ع د	١
<i>7</i> 7	_	 رت	ני	z	,

化合物 番 号	R ¹	R4	R ⁵	R6	OH OH
169	N N O	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	OH OH
170	H ₃ C N N O CH ₃	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
171	N H O	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
172	N CH ₃	-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-Н	OH OH
173	N O	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
174	N S	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
175		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH

主	_ 1	1 ((つ	づ	去)
277		١ ١	_	_	~	,

	40	•	1 (226)		
化合物 番 号	R 1	R 4	R 5	R 6	OH OH
176		-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	Н	OH OH
177		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
178		-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
179	CT _s	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
180	N H O	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
181	H ₃ C 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
182		-н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH

====		 -	_	٠.	`
7 27 ⋅	_	 つ	-)	===	,

化合物 番号	RI	R4	R5	R 6	OH OH
183	F	-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-Н	OH OH
184	C1 C1	Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
185	H ₃ C	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
186	F ₃ C C	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
187	CH30	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH
188	CH3O OCH3 O	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
189	CH30 0	-H	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-н	OH OH

表	_	1	(つづき)

	•				
化合物 番 号	R 1	R 4	R5	R6	OH OH
190	CH ₃ O OCH ₃	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
191	0 	-H	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
192	0 - S- H ₃ C 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	OH OH
193	H ₃ C	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
194	0 - s- 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
195	0 s- 0	-н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	OH OH
196	0 	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH

表 - 1 (つづき)

	z.	~	1 ())		
化合物 番 号	R 1	R ⁴	R 5	Re	A OH
197	0 = -	-CH ₃	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
198	0 - - - - -	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₃	OH OH
199	0=-=-	-CH ₃	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-СН _З	OH OH
200	0 - - - - -	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	OH OH
201	0 - - - 	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
202	F — S — 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
203	0 - s- C1 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	OH OH

夷	_	1	つ	づ	늄)

	•				
化合物 番 号	R 1	R4	R 5	R e	OH OH
204	0 - - 	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
205	c1 - S - 0	-#	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
206	0 	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
207	0 	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
208	Br — S — 0	-Н	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-н	OH OH
209	0 	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
210	0 - - - 	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH

表	 1	(つづき)	
AX.	1	\ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	

•		`			
化合物 番 号	R 1	R4	R ⁵	R6	OH OH
211	H ₃ C - S-	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	OH OH
212	H ₃ C - S - S - CH ₃ 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
213	CH ₃ 0 CH ₃ 0 CH ₃ 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH
214	H ₃ C 0 - - - - - - - - -	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
215	H ₃ C - CH ₃ 0 S - CH ₃ 0 CH ₃ 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
216	H ₃ ¢ - S - 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
217	H ₃ C S - S - 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH

	表	ŧ -	1 (つづき)		
化合物 番 号	R t	R 4	_R 5	R6	OH OH
218	$\begin{array}{c c} H_3C & 0 \\ H_3C & S- \\ H_3C & 0 \end{array}$	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-H	OH OH
219	OCH ₃ O	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH
220	CH ₃ O 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
221	СН ₃ 0 — В — В — В — В — В — В — В — В — В —	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
222	H ₃ C 0-	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
223	H ₃ C \ -0 - S - 0	-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-Н	OH OH

-CH2CH(CH3)2

-H

-H

ÒН

H₃C

H₃C-

H₃C

224

表	_	1 (つづ	(会)	١.
44					٠.

化合物 番 号	RI	R 4	R ⁵	R ⁶	OH OH
225	HO - S-	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
226		-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	OH OH
227	$\bigcup_{0_2 \mathbb{N}} \bigcup_{0}^{0} \bigcup_{0}^{\mathbb{N}} -$	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
228	$0_2 \mathtt{N} - $	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
229	0=0=0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	√ OH OH
230	0=5=0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
231	0 	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH

	3	₹ -	1 (つづき)		
化合物 番 号	R 1	R 4	R 5	R6	OH HO
232	0 - - - - -	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	OH
233	N = 0	-H	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
234	0 	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
235		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
236	0 	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
237	0 N = 5 I = 0 CH ₃	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
238	N 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH

表	-	1	(つこ	(き)
		_		

			. (
化合物 番 号	_R 1	R4	R 5	R6	OH OH
239	0=0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
240		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
241	н-	-Н	-CH ₂ -	-H	OH OH
242	H ₃ C 0 0	-Н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
243	H ₃ C O	-н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
244	H ₃ C 0 0	-Н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
245		-Н	-CH ₂ -	-Н	OH OH

	悬	ŧ -	1 (つづき)		
化合物 番 号	R 1	R 4	R ₂ 2	R6	OH OH
246		-н	-CH ₂ -	-H	OH OH
247		-н	-CH ₂ -	-н	OH OH
248	F 0 0	-Н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
249	CI	-н	-CH ₂ -	-н	OH OH
250	CI	-н	-CH ₂ -	-H	OH OH
251	CH ₃ 0	-н	-CH ₂ -	-н	OH
252	H ₃ C 0 0	-Н	-CH ₂ -	-н	OH OH

	ā	長 一	1 (つづき)		
化合物 番 号	R 1	R4	R ⁵	R ⁶	OH OH
253	OCH ₃ O	-H	-CH ₂ -	-Н	OH OH
254	CH ₃ O 0	-н	-CH ₂ -	-н	OH OH
255	N O	-Н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
256	H ₃ C 0	-Н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
257		-Н	-CH ₂ -	-Н	OH
258		-н	-CH ₂ -	-Н	OH
259	CI	-Н	-CH ₂ -	-Н	OH

	表	ŧ -	1 (つづき)		
化合物 番 号	R1	R 4	R 5	R 6	OH OH
260	CI	-Н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
261	CH ₃ 0 →	-Н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
262	H ₃ C O	-Н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
263	OCH ₃	-Н	-CH ₂ -	-н	OH OH
264	CH30 0	-н	-CH ₂ -	-H	OH OH
265		-н	-CH ₂ -	-н	OH OH
266	FO	-н	-CH ₂ -	-н	OH

	্ ই	支 一	1 (つづき)		
化合物 番 号	R 1	R 4	R 5	R ⁶	A OH
267	F	-н	-CH ₂ -	-H	OH OH
268	F	-н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
269		-н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
270	CI	-H	-CH ₂ -	-Н	OH OH
271	CI	-н	-CH ₂ -	-н	OH OH
272	CH ₃ O	-н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
273	H ₃ C 0	-н	-CH ₂ -	-Н	OH OH

	===	,	1 (つづき)		
	表	₹ -	1 (5558)		
化合物 番号	R I	R ⁴	R 5	Re	OH OH
274	H ₃ C 0	Н	-CH ₂ -	-н	OH
275	CH30 0	-Н	-CH ₂ -	-н	OH OH
276	CH30 0	-Н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
277	CH ₃ 0	-н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
278		-н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
279	N O	-н	-CH ₂ -	-Н	OH
280	N O	-н	-CH ₂ -	-Н	OH

海·	- 1	((つ	づ	き)

	•	X	1 (226)		
化合物 番 号	R1	R4	R5	R6	A O OH
281	0 	-н	-CH ₂ -	-н	OH OH
282	H ₃ C 0 S - 0	-н	-CH ₂ -	-н	OH OH
283		-н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
284		-Н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
285	F — S - 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0	-н	-CH ₂ -	- H	OH OH
286	c1	-Н	-CH ₂ -	-н	OH OH
287	Br	-н	-CH ₂ -	-н	OH OH

表 - 1 (つづき)									
化合物 番 号	R 1	R 4	R ⁵	R 6	OH OH				
288	H ₃ C - S - 0	-н	-CH ₂ -	-Н	OH OH				
289	CH ₃ 0 - S - 0 0 0 0 0 0 0 0 0	-н	-CH ₂ -	-Н	OH OH				
290	$0 \\ 0 \\ 0 \\ 0$	-Н	-CH ₂ -	-H	OH OH				
291		-н	-CH ₂ -	-Н	OH OH				
292	0 -\$- 0	-н	-CH ₂ -	-H	OH OH				
293		-н	-CH ₂ -	-Н	OH OH				
294	0 	-н	-CH ₂	-н	OH OH				

301

	·	長 -	1 (つづき)		
化合物 番 号	R ¹	R4	R5	R6	A OH
295		-н	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-Н	OH OH
296	0 	-Н	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-Н	OH OH
297		-н	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-Н	OH OH
298	0 - - - - -	-н	-сн ₂ ос (сн ₃) ₃	-Н	OH OH
299		-н	-CH ₂ OCH ₂ -	-Н	OH OH
300	0 =- s=- 0	-H	-CH ₂ OCH ₂ -	-н	OH OH

- -H

-CH₂OH

-H

ÓН

ÒH

	表	ŧ -	1 (つづき)		
化合物 番 号	R t	R 4	_R 5	R6	OH OH
302	0 - - - - -	-Н	-сн ₂ он	-Н	OH OH
303		-н	-Н	-н	CH ₃ OH
304	0 - 0	-Н	-Н	-Н	CH ₃ OH
305		-н	-СН3	-н	CH ₃
306	0 	-Н	-СН3	-н	CH ₃
307		-Н	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-н	CH ₃ OH
308	0 - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - - -	-н	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-Н	CH ₃

(つづき) 表 -化合物 R5 R 6 R 1 R 4 番号 309 -Н -CH(CH₃)₂ -H 0 -H $-CH(CH_3)_2$ -H 310

ÒΗ CH₃ ÒΗ CH3 ÒН 311 $-CH_2CH_2CH_2CH_3$ -H -H 0 ÓН CH3 0 312 -H -CH2CH2CH2CH3 -H ÓН CH3 $-CH_2CH(CH_3)_2$ -H 313 H--H ÓН CH₃ H₃C $-CH_2CH(CH_3)_2$ 314 -H -H ÓН CH3 $-CH_2CH(CH_3)_2$ 315 -H -H ÓН

表	 1	(つづ	き)

化合物 番号	. R 1	R 4	R ⁵	R ⁶	OH OH
316		-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	CH ₃ OH
317		-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	CH ₃ OH
318		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	CH ₃ OH
319	F 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	CH ₃
320	0 	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	CH ₃ OH
321		-н	-CH ₂ -	-н	CH ₃ OH
322	0 - - - - -	-н	-CH ₂ -	-н	CH ₃ OH

		長 —	1 (つづき)		
化合物番号	R 1	R 4	R5	R6	
323		-н	-сн ₂ сн ₂ sсн ₃	-Н	
324	0 = - = 0	-Н	-сн ₂ сн ₂ sсн ₃	-Н	

一番 亏		1			OH
323		-н	-сн ₂ сн ₂ scн ₃	-н	CH3 OH
324	0 	-н	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-н	CH ₃
325		-Н	-сн ₂ ос(сн ₃) ₃	-н	OH OH
326	0=0	-н	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-н	CH ₃ OH
327		-Н	-СН ₂ ОН	-Н	CH3 OH
328	0 - - - - -	-н	-сн ₂ он	-н	CH ₃
329		-Н	-	-Н	CH ₃ OH

	***************************************	ŧ -	1 (つづき)		
化合物 番 号	R ¹	R 4	R 5	R6	OH OH
330	0 - - 	-н		-Н	CH ₃ OH
331		-Н	-Н	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
332	0=	-Н	-Н	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
333		-н	-CH ₃	-н	H ₃ C CH ₃ OH
334	0 -s- 0	-н	-CH ₃	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
335		-н	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
336	0 - - - -	-Н	-сн ₂ сн ₂ сн ₃	-Н	H ₃ C CH ₃ OH

表 - 1 (つづき)

	•	× –	1 (JJe)		
化合物 番号	R 1	R4	R5	R ₆	OH OH
337		-н	-СН(СН ₃) ₂	-н	H ₃ C CH ₃ OH
338	0 = - = 0	-н	-СН(СН ₃) ₂	-н	H ₃ C CH ₃ OH
339		-н	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
340		-н	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-Н	H ₃ C CH ₃ O
341	Н-	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	H ₃ C CH ₃ OH
342	H ₃ C 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	H ₃ C CH ₃ OH
343		-н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-н	H ₃ C CH ₃ OH

	表	ŧ -	1 (つづき)		
化合物 番 号	R 1	R 4	R 5	R6	A O OH
344	F O O	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-H	H ₃ C CH ₃ OH
345	C1	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	- H	H ₃ C CH ₃ OH
346	Br O O	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
347	H ₃ C 0 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
348	CH30 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	H ₃ C CH ₃ OH
349	H ₃ C \	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	H ₃ C CH ₃ OH
350	H ₃ C 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃

-			/
麦	_	1	(つづき)

化合物	p.l	D 4	R ⁵	R6	(A)
番号	R 1	R 4	K° .	K ·	OH OH
351		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C. CH ₃ OH
352		-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
353		- H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
354	F	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	H ₃ C CH ₃ OH
355	CI	-н '	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
356	H ₃ C O	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
357	CH30 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH

	麦	ŧ -	1 (つづき)		
化合物 番 号	R 1	R 4	R 5	R 6	OH OH
358	CH ₃ O OCH ₃ O	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	H ₃ C CH ₃ OH
359		-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	H3C CH3
360	→ C F	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H3C CH3
361	F	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
362	F	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
363	Cl O	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	H ₃ C CH ₃ OH
364	CI	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃

夷	 	(つ	イ	¥	`
22			_	~~	,

	·				
化合物 番号	R 1	R ⁴	R5	Re	OH OH
365	CH ₃ O	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	H ₃ C CH ₃ OH
366	H ₃ C 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
367	CF ₃ 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	~H	H ₃ C CH ₃ OH
368	F ₃ C 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	H ₃ C CH ₃ OH
369	CH ₃ 0	-н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-н	H ₃ C CH ₃ OH
370	CH ₃ 0 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
371		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH

表	_	1	(-	つづ	き)

	2	•			
化合物 番 号	R 1	R 4	R 5	R 6	OH OH
372	$N \longrightarrow 0$	-н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	H ₃ C CH ₃ OH
373	o Cz	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
374		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
375	S	-н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
376	0 	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	H ₃ C CH ₃ OH
377	H ₃ C	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	H ₃ C CH ₃ OH
378	0 	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH

涄	_	1	(つ	づ	*)
-ax			` ` _	_	⊂ .	,

化合物 番 号	R ¹	R 4	R5	R ⁶	OH OH
379	F — S — 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	H ₃ C CH ₃ OH
380	c1 — S — S — 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
381	Br -	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	H ₃ C CH ₃ OH
382	н ₃ с - С 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	H ₃ C CH ₃ OH
383	H ₃ C - CH ₃ 0 S - CH ₃ 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
384	H ₃ C 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	H ₃ C CH ₃ OH
385	CH ₃ O - S - S - S - S - S - S - S - S - S -	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH

	表	ŧ -	1 (つづき)		
化合物 番 号	R 1	R 4	R 5	R е	OH OH
386	$0 \\ \parallel \\ 0_2 \\ \parallel \\ 0$	-н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	H3C CH3
387	0 - - - - -	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
388	0 	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
389	N = 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
390	0 	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
391	Н-	-Н	-сн ₂ -	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
392	H ₃ C 0 0	-Н	-CH ₂ -	-н	H ₃ C CH ₃ OH

表	_	1 (()	づき)
48			· - ·	- 5

化合物 番号	R 1	R 4	R 5	Re	OH OH
393		-н	-CH ₂ -	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
394	F 0 0	-H	-CH ₂ -	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
395	CI	-Н	-CH ₂ -	-Н	H3C CH3 OH
396	H ₃ C 0	-Н	-CH ₂ -	-н	H ₃ C CH ₃ OH
397	CH ₃ 0	-Н	-CH ₂ -	-н	H ₃ C CH ₃ OH
398		-Н	-CH ₂ -	-Н	H3C CH3 OH
399		-Н	-CH ₂ -	-H	H3C CH3

表	 1	(つづき)
AY.		(/

		•	1 (2 4 4 7		
化合物 番 号	Rı	R ⁴	R5	R ⁶	OH OH
400	CH ₃ 0	-Н	-CH ₂ -	-н	H ₃ C CH ₃ OH
401	CH ₃ O OCH ₃ O	-Н	-CH ₂ -	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
402		-Н	-CH ₂ -	-н	H ₃ C CH ₃ OH
403	F 0	-Н	-CH ₂ -	-н	H ₃ C CH ₃ OH
404	F O	-н	-CH ₂ -	-н	H ₃ C CH ₃ OH
405	F	-Н	-CH ₂ -	-н	H3C CH3
406	F ₃ C F 0	-Н	-CH ₂ -	-н	H ₃ C CH ₃ OH

丰	_	1	()	づき)
77	_	1		_	,

化合物	R 1	R 4	R5	.R6	(A)
番号	η -	Α.	N.	. K	OH
407	0 	-Н	-CH ₂ -	-H	H ₃ C CH ₃ OH
408		-Н	-CH ₂ -	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
409	F — S — 0	-Н	-CH ₂ -	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
410	CH ³ 0 - S - 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0	-н	-CH ₂ -	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
411		-Н	-CH ₂ -	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
412		-Н	-CH ₂ -CH ₂	-H	H ₃ C CH ₃ OH
413		-Н	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-Н	H ₃ C CH ₃ OH

表	_	1	(つづき)
_			

化合物 番 号	R 1	R 4	R ⁵	R6	OH OH
414	0 = - = 0	-Н	-сн ₂ сн ₂ scн ₃	-н	H ₃ C CH ₃ OH
415		-н	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
416	0 - - - - -	-H	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-н	H ₃ C CH ₃ OH
417		-н	-CH ₂ OH	-н	H ₃ C CH ₃ OH
418	0 -s- 0	-Н	-сн ₂ он	-Н	H ₃ C CH ₃ OH
419		-н		-н	H ₃ C CH ₃ OH
420	0 - - - - -	-Н		-н	H ₃ C CH ₃ OH

	ā	長 一	1 (つづき)		
化合物 番 号	R1	R 4	R ⁵	R6	A OH
421		-н	-Н	-н	OH OH
422	0 	-н	-н	-н	OH OH
423		-Н	-CH ₃	-н	OH OH
424	0 = - = 0	-н	-СН _З	-Н	OH OH
425		-н	-сн ₂ сн ₂ сн ₃	-н	OH OH
426	0 	-н	-сн ₂ сн ₂ сн ₃	-Н	OH OH
427		-Н	-сн(сн _з) ₂	-Н	OH OH

	· 表	ŧ –	1 (つづき)		
化合物 番 号	R 1	R 4	R ⁵	R ⁶	OH OH
428	0 - - - 0	-Н	-сн(сн _з) ₂	-Н	OH OH
429		-н	-сн ₂ сн ₂ сн ₂ сн ₃	-Н	OH OH
430	0 - - - - -	-н	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	-Н	OH OH
431	-Н	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
432	H ₃ C 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	OH OH
433		-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
434	FOO	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH

表	_	1 ((つ	づ	¥	١
77	_	1 (~	,

	3				
化合物 番 号	R ¹	R 4	R 5	R ⁶	OH OH
435	CI	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
436	Br 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
437	H ₃ C 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
438	CH ₃ 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
439	Н₃С	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
440	H ₃ C O	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	₩
441		-н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-Н	OH OH

表	 1	(()	づ	去)
ZX.	1	١,	_		Ç	•

	•				
化合物 番 号	R 1	R 4	R 5	R 6	OH OH
442		-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
443		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
444	F	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
445	CI	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	OH OH
446	H ₃ C O	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
447	CH30 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
448	H	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	OH OH

		表 —	1 (つづき)		
化合物 番 号	RI	R ⁴	R ⁵	Re.	A OH
449		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
450	FO	-H	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-н	OH OH
451	F	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
452	F C	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
453	5-5-0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
454	CI	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	SH OH
455	CH ₃ O	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-н	OH OH

表	_	1	(つづき)	
4×			\ - - - . /	

	•	•			
化合物 番 号	R I	R 4	R5	R 6	OH OH
456	H ₃ C 0	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
457	CF ₃ 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
458	F ₃ C 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
459	CH ₃ 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
460	CH ₃ 0 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
461	N O	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
462	N O	-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-Н	OH OH

表 - 1 (つづき)

化合物番号	R 1	R 4	R5	R 6	OH OH
463	N O	-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	F -
464		-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
465	. (8)	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
466	0 	-н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-Н	OH OH
467	H ₃ C	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
468	0 = s = o	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
469	F — S - 0	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	OH OH

表	_	1	(つづき)
表	_	1	(つづき)

化合物 番 号	R t	R ⁴	R 5	Re	OH OH
470	C1 - S - 0	-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-Н	OH OH
471	Br → S − 0	-н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-H	OH OH
472	H ₃ C - S - 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
473	CH ₃ 0 CH ₃ 0	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-H	OH OH
47.4	$\begin{array}{c c} H_3C & 0 \\ H_3C & -S - \\ H_3C & 0 \end{array}$	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
475	CH ₃ 0 - S - 0	-Н	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-н	OH OH
476	$0 \\ 0 \\ 0 \\ 0$	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH

表 - 1 (つづ	ŧ)	
-----------	---	---	--

		•	1 (220)		
化合物 番 号	R1	R 4	R 5	R6	OH OH
477	0 	-н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
478	0 	-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Ĥ	OH OH
479	N = 0 = 0 = 0	-Н	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
480		-Н	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	○ BH
481	H- ,	-Н	-CH ₂ -	-Н	~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~
482	H ₃ C 0	-н	-CH ₂ -	-Н	₩
483		-н	-CH ₂ -	-н	€

表 - 1 (つづき)							
化合物 番 号	R 1	R 4	R 5	R ⁶	OH OH		
484	F 0 0	-н	-CH ₂ -	-н	OH OH		
485	CI	-Н	-CH ₂ -	-Н	OH OH		
486	H ₃ C 0	-Н	-CH ₂ -	-Н	OH		
487	CH ₃ 0	-н	-CH ₂ -	-Н	OH OH		
488		-н	-CH ₂ -	-н	OH OH		
489		-Н	-CH ₂ -	-н	OH OH		
490	CH30	-Н	-CH ₂ -	-н	OH OH		

夷	1	1 4	(つ	べ	¥	١
27			رر	٠,	74	,

化合物 番 号	R1	R 4	R ⁵	R6	OH OH
491	CH ₃ O OCH ₃ O	-н	-CH ₂ -	-н	OH OH
492		-Н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
493	FO	-Н	-CH ₂ -	-н	OH OH
494	F	-н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
495	F F O	-н	-CH ₂ -	-н	OH OH
496	F ₃ C 0	-Н	-CH ₂ -	-H	OH OH
497	О 	-н	-CH ₂ -	-н	OH OH

	.	ŧ -	1 (つづき)		
化合物 番 号	R 1	R 4	R ⁵	R6	A O OH
498	0 	-н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
499	F — S – 0	-н	-CH ₂ -	-H	OH
500	CH ₃ O - S - 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0	-Н	-CH ₂ -	-н	OH OH
501		-н	-CH ₂ -	-Н	OH OH
502	0 -s- 0	-н	-CH ₂ -CH ₂	-Н	OH OH
503		-н	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-H	OH OH
504	0 - s- 0	-Н	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-Н	OH OH

	Z	長 —	1 (つづき)		
化合物 番 号	K 1	R 4	R5	Re.	OH OH
505		-Н	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-Н	OH OH
506	0=5=0	-Н	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-Н	OH OH
507		-Н	-сн ₂ он	-Н	OH OH
508	0 	-н	-сн ₂ он	-Н	OH OH
509		-н		-Н	OH OH
510	0 - - - - -	-н	-	-Н	OH OH
511		-H	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₃ СО	OH OH

	ā	長 -	1 (つづき)		
化合物 番 号	R 1	R4	R ⁵	R6	OH OH
512		сн _з со-	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-Н	OH OH
513	0 - - - - - -	CH3CO-	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-H	OH OH
514	F — S — 0	CH3CO-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
515	H ₃ C - S - 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0	сн ₃ со-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH
516	CH ₃ 0 - S - 0 0 0	CH ₃ CO-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
517		сн ₃ со-	-CH ₂ -	-н	OH OH
518	0 	CH3CO-	-CH ₂ -	-н	OH OH

表 -	1	(つづき)

化合物番号	R ¹	R 4	R5	R e	OH OH
519		сн _з со-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-н	OH OH
520	0 	сн ₃ со-	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-Н	OH OH

	₩ -0	०	0-6	0-0	○
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(n=0の場合)	R 6	#-	. #	#	7
- 2	R5	# -	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-СН (СН ₃) ₂
表	R4	#	7	Н-	7
	R.				
	化合物番号	521	522	523	524

	0 0-	0-0	0 -0	0-0	00
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	7	ŗ	7	7
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂
i	R4	F-	H-	H-	Ŧ
	R 1		H-	H_3^{C} \downarrow 0 \downarrow H_3^{C} \downarrow 0	
	化合物番号	525	526	527	528

	₩ -0		° - 6		○
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	#	7	#	Ŧ
表 - 2 (2	R5	-СН ₂ СН(СН ₃)2	-СН ₂ СИ (СН ₃)2	-СН ₂ СН (СН 3) 2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	F	#	Н-	# -
	R.1				
	化合物番号	529	530	531	532

		r	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·		
	(A) 0-0	0	0 →	0	00
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	Ŧ	Ŧ	Ŧ	7
表 - 2 (5	R5	-CH ₂	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-CH ₂ OH	
	R4	#	7	7	7
	R1				
	化合物番号	533	534	535	536

	0-0		0 -0	0-0	0-0
	R.7	CH ₃	CH ₃) O	CH ₃
(つつき)	9 %	#	-	#	7
表 - 2 (5	R5	=	-CH ₃	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₃
	R 4	#	#	Н-	#
	R 1				
	化合物番号	537	538	539	540

	(A) 0	0	0-0	0-0	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	#	#-	H-	₩-
表 - 2 (5	R5	-СН(СН ₃) ₂	-CH2CH2CH3	-CH CH ₃	-СН ₂ СН (СН ₃)2
	R 4	#	H -	#-	Ŧ
	R 1				:
	化合物番 号	541	542	543	544

	0-0	0-0		0	0 -0
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	#	7	=	==
表 - 2 (5	. R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R4	Ŧ	=	Ŧ	=
	. I M	H³c 0	H ₃ C < 0	H ₃ C 0 H ₃ C 0	H ₃ C 0
	化合物番 号	545	546	547	548

•				_	
	0 0		-6	\rightarrow	\$\doldsymbol{\phi} \doldsymbol{\phi} \doldsymbol
	~ ~	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	92	7	. #	Ŧ.	Ŧ
表 - 2 (元	RS	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН 3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R 4	#-	Ŧ	H-	-CH ₃
	R1				
	化合物	549	. 220	551	552

表 - 2 (つづき)	$R5 \qquad R6 \qquad R7 \qquad \stackrel{A}{\longleftarrow} 0$	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -CH ₃ \bigcirc	$-CH_2CH(CH_3)_2$ $-CH_3$ 0 0	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -H CH ₃	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂ -H
2				·	
嵌	R4	Ð- H-	-CH ₃ -Cl	Э- Н-	9
	- X			- H	A 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0
	化合物番号	553	554	555	556

•	0 0 0	0-0	0-0	0-0	
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	#	Ŧ	#	
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	H-	Н-	7	7
	R1				
	化合物番号	557	558	559	260

					•
表 - 2 (つづき)	₩ -0		0	-6	
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R6	7	Ŧ	Ŧ	Ŧ
	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	# -	Ŧ	#-	# 1
	R 1	B B	\mathbb{R}^{r}		CH ₃
	化合物番号	561	295	563	564

	₩ -0	-i0		0	0-0
表 - 2 (つづき)	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R6	7	#-	*	#
	R5	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	=	=	Н-	Ŧ
	R I	H ₃ C	H ₃ C 0	0CH ₃ 0	$CH_30 \\ \bigcirc \\ 0 \\ \bigcirc \\ 0$
	化合物番号	565	566	567	268

	R7 (A) 0-	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	+	#	· Ŧ	=
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН 3)2	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂
	R4	#-	7	# -	Ŧ
	R 1	CH ₃ 0 CH			
	化合物番号	269	570	571	572

					
	(A)	0	0	0	0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	RG	Ŧ		#	#
表 - 2 (元	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	H-	H-	H-	Ŧ
	R.1		N 0		
	化合物 番号	573	574	575	576

	V -0	0-0	0-0	0-0	0-0
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	#	Ŧ	7	. Ŧ
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R4	7	Ŧ	Ŧ	Ŧ
	R.				
	化合物	577	578	579	580

	(A) 0-	0 -0	0-0	0-0	0 -0
	. R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CII3
(つづき)	R6	#	7	#-	#-
表 - 2 (元	R5	-СН ₂ СН (СН ₃)2	-CH ₂ CII (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	#	H -	H-	Ŧ
	R 1 ·		$\bigcup_{N} H$	N N O	ll₃c ∕∕ 0
	化合物番号	581	282	583	584

	Q-0	0-0	Q-0	0-0	
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R G	Ŧ	Ħ.	Ŧ	Ŧ
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	#	Ŧ	#-	Ŧ
	R 1	H ₃ C	H ₃ C \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	H ₃ C 100 100 100 100 100 100 100 100 100 10	H ₃ C D ₁ H
	化合物番 号	585	586	587	588

	0 0 0	0-0	0-0	~ 6	
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	Re	=	Ŧ		=
表 - 2 (7	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
,	R 4	#	#	Н-	#
	I M	H ₃ C	H ₃ C H ₃ C H ₃ C H ₃ C	H ₃ C \ \ 0	H ₃ C
	化合物番号	589	. 290	591	292

	₩	Ç-6	0-0	0-0	0-0
	R7	CH3	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R G	7	7	Ŧ	#
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R 4	# -		¥	=
	. N	H ₃ C 0	CH ₃ (CH ₂) ₅	СН ₃ (СН ₂) 6	СН ₃ (СН ₂) ₉
	化合物番号	593	594	595	296

	A -0	0-0	0-0	0-0	0 -0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	Ŧ	Ŧ		Ŧ
表一2(7	R5	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂
; ;	R 4	7	7	7	Ŧ
	R 1	CH ₃ (CH ₂) ₁₀	СН ₃ (СН ₂) ₁₂	CH ₃ (CH ₂) ₁₄	
	化合物番号	597	298	299	009

	V -0			Ç-6	0-0
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	7	*	7	Ŧ
表 - 2 (5	R5	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2	-сн ₂ сн (сн _{3) 2.}	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4		7	Ŧ	Ŧ
	- N				
	化合物番号	601	602	603	604

_					
	0 0-0	Ç-6	0-0		0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R G	.	=	#-	H-
表 - 2 (2	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	7	#-	H-	Ŧ
	R1 .			Н ₃ с ∕0∕	H ₃ C H ₃ C H ₃ C 0
	化合物番号	909	909	209	809

	(V)	0-0	0-0	0-0	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	· -	Н-	. Н-	#
表一名(つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂
	R4	H-	H-	#	干
	R 1				F O
	化合物番 号	609	610	611	612

	(A) 00	0-0	0-0	0-0	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	. #	Ŧ.	# -	#
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂
	. R4	#	Н-	H-	7
	R 1	F D			
	化合物番号	613	614	615	616

	Q-0	0-0		°	0-0
	R.7	CH ₃	CH3	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	Ŧ	Ŧ	Ŧ	
表 - 2 (5	R5	-CH2CH(CH3)2	-сн ₂ сн (сн ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) 2
	R4	7	н-	Ŧ	Ŧ
	R.1	OCH ₃	CH ₃ 0 0 CH ₃ 0	CH ₃ 0 CH ₃ 0	CH ₃ 0 CH ₃ 0CH ₃
	化合物	617	618	619	920

·	0-0	0-0	0-0	° -6	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R.G.	=	7	#	. =
表 - 2 (4	RS	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	#	#-	H-	#-
	R !	CH ₃	H ₃ C O O	H ₃ C	CF ₃
	化合物番 号	621	622	623	624

	Q-0		0	0-0	
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	-	#	7	Ŧ
表 - 2 (2	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃)2
	R 4	*	#-	Ħ,	Ŧ
	. A	F ₃ C	F ₃ C 0 0		
	化合物番号号	625	626	627	628

	0-0	0 -0		0	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	H-	Ŧ	H-	· ==
表 - 2 (2	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R4	· #-	Н-	Ŧ.	Ŧ
	R 1				
	化合物番号	629	630	631	632

	A -0		0-6	○	0-0
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	Re	#-	Ŧ	Ŧ	-
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R4	Ŧ	Ŧ	₹	+
	R.1	- C-			
	化合物 番 号	633	634	635	636

	(A) 0-0	0-0	0-0	0-0	0-0
	. R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	Н-	₽ .	₹ .	Ŧ
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃)2	-СИ ₂ СН (СН ₃) ₂
	R4	H-	Н-	# -	7
	R I	P Q	F F	0 13	CI
	化合物番号	637	638	639	640

	₩ 0-0	0-0		0-6	0-6
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つつき)	R 6	7	F	7	7
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	H-	H-	. н-	Ŧ
	R1		Br 0	Br	Br.
	化合物番号	641	642	643	644

	₩ -0	0-0		~	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	RG	∓.	#	=	7
表一2(八	R5	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R 4	*	н-	#-	*
	R 1	# o = 0	$H_3^{C} \longrightarrow 0$	H ₃ C	H ₃ C CH ₃ O
	化合物番号	645	646	647	648

	0-0		○	0-0	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つつき)	% e	∓.	· 平	Ŧ	푸
表 - 2 (5	R 5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂
	R4	#	Ŧ	#	Ŧ
	. R. I	CH ₃	H ₃ C 0	H ₃ C CH ₃	H ₃ C
	化合物番号	649	650	651	652

	(A)	0-0	0-0	0 -0	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(カグギ)	R6	#	7	F	=
表 - 2 (つ	R5	-СН ₂ СН(СН ₃)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃)2	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂
	R 4	# -	H-	н-	7
	RI	H_3c	H ₃ C	CF ₃	P_3c
	化合物番号	653	654	655	929

	0 0-0		0-0	Ç-6	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つつき)	R 6	. H	Ŧ	#	Ŧ
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R 4	H-	"	干	Ŧ
•	R.1	F ₃ C O	CH ₃ O O	CH ₃ O	CH ₃ 0
	化合物番号	657	658	629	099

	(A) 00	0	0	0-0	0-0
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	#-	н-	#-	#
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R4	· #	H-	н-	#
	R 1	CH ₃ 0 CH ₃ 0 0	CH ₃ 0 0	CH ₃ 0 CH ₃ 0	CH ₃ 0
	化合物番号	661	299	£99	. 664

	0 - 0	0	0-0	○ -6	-0
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	Re	푸	Ŧ	7	7
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	% 4	=	Ŧ	#-	7
	. R. I	CH ₃ O CH ₃	H ₃ C 0	H ₃ C > ₀	H ₃ C 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0
	化合物番号	999	999	667	899

	(A)	0-0	0-0	0-0	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	Ŧ	н-	#-	. ¥
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	7	H -	H-	Н-
	R I	H ₃ C \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	HO OH		
	化合物番 号	699	029	671	672

	0 -0	0-0	0-0	0-0	0 0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	T	Ŧ	¥	₹
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂
	R4	7	푸	#	Ŧ
	R 1		1 ()	9±	
	化合物番号	673	674	675	676

	-0 0	0-0	00	0-0	0-
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	.	#	Ŧ	#
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂
	(R4	H-	Ŧ	#-	#
	R1		N O	N 0	
:	化合物番号		678	619	089

	0 -0		0 -0	0-0	0 0
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	T	Ŧ.	#-	干
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂
	R4	#	Ŧ	Ŧ	#
	. R 1			s	S
	化合物番号	681	289	683	684

	₩ <u></u> -0	Ç-6	0-0		
	R.7	CH3	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	#	# _	7	7
表 - 2 (2	RS	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН 3)2
	R4	푸	7	Ŧ	H-
	R 1	N H	H	CH ₃	CH ₃
	化合物番号	685	989	687	889

	0-0	Ç-6	Ç-6		~ · ·
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	RG	# .	#	Ŧ	7
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
٠	. R4	7	Ŧ	Н-	Ŧ
	1 N	Z	H ₃ C N CH ₃ O	N H	CH ₃
	化合物番号	689	069	691	692

					
	0-0	Ç-6	0-6	~-o	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6		Ŧ	. ¥	#
表 - 2 ()	RS	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2	-сн ₂ сн (сн 3) 2
	R4	7	7	7	#
	- w		Z S		
	(1) (1) (1) (1) (1) (1) (1) (1) (1) (1)	1 8	694	982	969

	\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\		0-6		0-0
	R.7	CH3	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	æ e	*	÷	푸	Ŧ
表 - 2 (1	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(СН ₃) ₂
	R 4	F	7	-H	Ŧ
	I Xi			S	N H
	化合物 番 号	697	869	669	700

	(A) 00	0-0	00	0-0	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	СН3
(つづき)	R6	#	#	H-	Н-
表 - 2 (2	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	Ŧ.	Н-	Н-	H-
	R i	H ₃ C \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \		F O	
	化合物番 号	701	702	703	704

	0 -0	0-0		0-0	0-0
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH 3
(つづき)	R6	Ŧ	Ŧ	#-	Ŧ
表 - 2 (2	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R 4	#-	7	Ŧ	*
	R.1	H ₃ C	F3C	CH ₃ 0	CH ₃ 0 OCH ₃
	化合物番号	705	706	707	708

	-0 0-	0-0	0-0	0-0	0-0
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	#	Н-	Н-	#
表 - 2 (元	R5	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH (CH 3)2	-СН ₂ СН (СН 3) ₂
	R4	H-	Н-	н-	7
	. R 1	CH ₃ 0 CH	CH ₃ 0 OCH ₃	H ₃ C-S- II 0	0
	化合物番号	402	012	7111	712

	0 -0		0	0-0	0-0
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	Ŧ	T.	#	Ŧ
表 - 2 (2	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂
	R 4	Ŧ	干	Ŧ	Ŧ
	1.8	H ₃ C = 0	0==0	0=8=0	0===0
	化合物番号	713	714	715	716

					
	₩ -0	Ç-6		0-0	Ç-6
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つつき)	Re	=	-CH ₃	-CH3	Ŧ
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R 4	-GH ₃	Ŧ	CH3-	Ŧ
	R 1	0=0=0	0=0=0	0==0	0=0=0
	化合物番号	717	718	719	720

	√ 0-0		0-0	0-0	
	R.7	CH ₃	CH3 CH3	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	. ;	# -	#	7
表 - 2 (7	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂
	R4	#-	#	H-	H-
	RI	0===0			0==s=0
	化合物番号号	721	722	723	724

	~	Ç-6	0-0	0-6	0-0
•	R.7	CH ₃ CH ₃	CH ₃	CH ₃	
(つづき)	R6	#	Ŧ	H-	Ŧ
表 - 2 (2	R5	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R 4	= 1		Ŧ	Ŧ
	- R	0=0=0	0==0	0==0	0===0
	化合物番号	725	726	727	728

	₩	0-0	0-6	0 -0	~- d
	R7	P P	50	-5	-0 -5 -5
(つづき)	R6	#	#-	Ŧ	Ŧ
表 - 2 (5	R ⁵	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-сн ₂ сн (сн ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН 3)2
	R4	Ŧ	Ŧ	H -	푸
	. R	0=0	0===0		
	化合物番号	729	730	731	732

	₩ -0	0-0	0-0	0	0-0
	R7	CH ₃	CP3	0СН3	CH ₃
(つづき)	R6	Ŧ	H-	Ŧ	H-
表 - 2 (7	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R4	#	7	干	干
	R 1		0===0	0===0	0===0
	化合物番 号	733	734	735	736

٦٠	——т				
	₩\-0	0	-0	0-0	
	R7	0 CH ₃	CH ₃		
(つづき)	R 6	#-	Ŧ	Ŧ	#-
表 - 2 (2	R5	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2
	R 4	=======================================	7	Ŧ	#
	R.1	0=\$=0	0==0	0==0	0=0=0
	化合物番号	1 8	738	739	740

	(A) 0	0-0	0	0-0	0-0
	R7 .	-CH ₃	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-CH(CH ₃) ₂
(つづき)	R6	H-	7	#-	7
表一2(与	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R4	Ŧ	н-	#	#-
·	R 1				
	化合物番 号	741	742	743	744

	₩ -0	0-0	0-6	Ç-6	Ç-6
	R.7	-CH2CH2CH3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-C(CH ₃) ₃	-CH2CH2CH(CH3)2
(つづき)	R6	#-	H-	H-	Ŧ
表 - 2 (5	R5	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃)2
	R4	7	Ŧ	Ŧ	Ŧ
		0===0	0=0=0	0=0=0	0 = S = 0
	化合物番号	745	746	747	748

		·			
	₩ 0 0	0	0-0	0-0	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	86	· "	#	· Ŧ	7
表 - 2 (7	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂
	R4	H-	#-	H-	# .
	R1	0 		$P \longrightarrow \begin{matrix} 0 \\ \vdots \\ I \\ 0 \end{matrix}$	
	化合物番号号	749	750	751	752

	0 0 -0		Ç-6	0-0	0-0
	. R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃ CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	H-	Ŧ	7-	Ŧ
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R 4	7	平	푸	#
	1 N	0=0=0	0==0		9r 0=8=0
	化合物	T53	754	755	756

	(A)	0-0	0-0	0-0	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	7	F-	#	Ŧ
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂
	R4	H-	Н-	Н-	Ŧ
	R 1	$\begin{cases} & 0 \\ & \parallel \\ & \parallel \\ & \parallel \\ & 0 \end{cases}$	$\mathbb{B}^r \stackrel{0}{\longleftarrow} \mathbb{S}^-$	CH ₃ 0	H ₃ C
	化合物番 号	757	758	759	760

	₩ <u></u>		Ç-6	~ -6	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つつき)	R6		#	7	푸
表 - 2 (7	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	Ŧ	Ŧ	7	Ŧ
	18	H ₃ C = 0	H ₃ C CH ₃ 0	CH ₃ 0 CH ₃ 0 CH ₃ 0	$H_3C \longrightarrow \begin{bmatrix} 0 \\ -S \\ - \\ 0 \end{bmatrix}$
	化合物番号	761	762	763	764

	A -0	\ \(\rac{1}{2} \rac{1}{2} \rightarrow \frac{1}{2} \ri	°>-	- - -	°>-
		\prec	<u> </u>	\searrow	<u> </u>
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	. #	#	Ŧ	Ŧ
表 - 2 (7	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	7	Ŧ	7	Ŧ
	R I	$H_3C \xrightarrow{CH_3} 0$ $CH_3 0$ $CH_3 0$	$H_3C \longrightarrow \begin{bmatrix} 0 \\ \parallel \\ 0 \end{bmatrix}$	H_3C H_3C 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0	$\begin{array}{c} {\rm H_3C} \\ {\rm H_3C} \\ {\rm H_3C} \end{array} \longrightarrow \begin{array}{c} 0 \\ \parallel \\ 0 \end{array}$
	化合物番号	765	766	767	768

	0-0	0-6	~ d		
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	干	#	7	. #
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	#-	Ŧ	H-	Ŧ
	1 A	OCH ₃ 0	CH ₃ 0	CH ₃ 0 - S - S - 0	H_3C 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0
	化合物番号号	769	770	77.1	772

	₩ -0				
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	₹ , .	. Ŧ	于	Ŧ
表一名(つ	R5	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	#	#-	*	#
	R 1	$H_3^{C} \longrightarrow 0 \longrightarrow 0$	$H_3^{C} \longrightarrow 0$ $H_3^{C} \longrightarrow 0$ $H_3^{C} \longrightarrow 0$	H0 \$\begin{pmatrix} 0 & \\ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	NO ₂ 0
	化合物番 号	773	774	775	776

	W -0		0-0	0-0	○
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(ラブき)	R 6	Ŧ	Ŧ	#	Ŧ
表 - 2 (2	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂
	R4	7	Ŧ	#-	7
	R.1	0=-s=0	$0_{2N} \xrightarrow{0} 0_{S-}$	0=%=0	0=\$=0
	化合物 母 号	777	778	<i>TT</i> 9	780

		·	·		
	₩ 0	0-0	0-0	-6	
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	, "	Ŧ	7	=
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R 4	7	H-	H-	. #-
	R¹		$ \begin{array}{c} 0 \\ N \\ \end{array} $		0
į	化合物番号	781	782	783	784

	0-0	Ç-6	Ö-6	Ç-6	0-0
	۳۶	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	. Ŧ	Ŧ	7	
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-сн ₂ сн(сн ₃₎₂
	R4	#-	Ŧ	Ŧ	Ŧ
	. W	-S-0 -S-0 -S-0 -S-0 -S-0 -S-0 -S-0 -S-0	0 = S = 0	CH ₃	
	化合物番号	785	786	787	788

	₩ -0	0-0	0-0	0-0	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	#	H-	H-	Ŧ
表 - 2 (5	R5	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ -	-CH ₂
	R4	Ŧ.	Ŧ	Ŧ	Ŧ
	R 1	0 N 0	$\bigvee_{N} \bigvee_{0}^{0}$	#	H ₃ C 0
	化合物番号	. 789	790	791	792

	W -0	° -ċ	Ç-6		
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	. CH3
(つづき)	98	F	, F	#	7
表 - 2 (つ	RS	-CH ₂ -	-CH ₂	-CH ₂ -	-cH ₂
	R 4	#		7	#
		H ₃ C 0 H ₃ C 0	H ₃ C 0 H ₃ C		
	化合物番号	793	794	795	962

	A 0-0		0-0	0-0	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	=	. 7	Ŧ	Ŧ
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ -	-CH ₂ -	-CH ₂ -	-CH ₂ -
	R4	#	#-	H-	.
	R l	F 0			
	化合物番 号	797	798	799	008

	V -0	0-0	0-0	0-0	-0
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH3	CH ₃
(つづき)	R G	#	=	7	#
表一2(元	R5	-CH ₂	-cH ₂	-CH ₂	-CH ₂
	R 4	*	#	H-	H-
	1.8	CH3 O O	H ₃ C 0	0CH ₃	CH ₃ 0 0 0
	化合物番号	801	802	803	804

	W -0	0-6	~ 6	~ -6	~ 6
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	RG	· #	#	Ŧ	#-
表一2(八	R5	-CH ₂	-CH ₂ -	-сн2-	-CH ₂ -
	R4	"	#	7	7
	R 1	D H N	H ₃ C		
	化合物番 号	802	806	807	808

	₩ -0	-	0-0	-0	0-0
	R.7	CH ₃	CH3	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	. F	푸	*	
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂	-CH ₂
	R4	Ŧ	Ŧ	Ŧ	Ŧ
	R 1			G. S.	H ₃ C
	化合物番 号	608	810	811	812

	(A) 00	0-0	0-0	00	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	Ŧ.	Ŧ	# ,	#-
表 - 2 (7	R5	-CH ₂ -	-CH ₂ -	-CH ₂ -	-CH ₂ -
	R4	Ŧ	Н-	H-	Ŧ
	R.1	0CH ₃	CH ₃ 0 CH ₃ 0		F 0
	化合物番号	813	814	815	816

	A -0		0-0	0-0	Ç-6
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	S C C
(つづき)	R 6	7	=	7	#
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ -	-cH ₂	-CH ₂	-CH ₂ -
	R4	#-	Ŧ	Ŧ	Ŧ
,	R 1				50
	化合物番号	817	818	819	820

	-0 -0	0-0	0-0	00	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	Ĥ-	Ŧ	H-	. #
表 - 2 (元	R5	-CH ₂ -	-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂
	R4	#	H-	Н-	
	R 1	CI CI	CH ₃ 0	H ₃ C 0	H ₃ C
	化合物番号	821	822	823	824

	₩ -0	0-6	0-0	-	0
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	=	Ŧ.	-	*
表 - 2 (2	R5	-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂
	R 4	₹.	Ŧ	H-	H-
	R 1	CH30 O	CH ₃ 0	CH ₃ 0	Z
	化合物番号	825	826	827	828

	(A) 0	0-0	0-0	0 -0	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	#	H -	Ŧ	Ŧ
表 - 2 (7	R5	-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂
	R 4	#-	#-	#-	7
	R 1	\sim	N 0	H ₃ C-S-	H ₃ C
	化合物番号	829	830	831	832

	Q -0		0-0	0-0	0-0
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH 3
(つづき)	R6	· 7	Ŧ	7-	Ŧ
表 - 2 (0	R5	-cH ₂	-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂
	R 4	=	7	.	¥-
		0=%=0	0==0	-S0	
•	化合物番号	833	834	835	836

	₩ -0	0-0		0	0-6
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	#	#	#	干
表一2(万	R 5	-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂
	R4	7	푸	H-	Ŧ
	R1 .	Br 0 0 0	H ₃ C - S - II	CH ₃ 0 - S - S - B - S - B - CH ₃ 0	$0 \\ 0 \\ 0 \\ 0$
	化合物番号	837	838	839	840

:

.

	₩ -0	0-0	0-0	0-0	
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(カンな)	R6	=	. #-	*	
表 - 2 (7	RS	-cH ₂	-CH ₂	-cH ₂	-CH ₂
	R4	Ŧ	*	Ŧ	Ŧ
			0==0		0=%=0
	化合物	841	842	843	844

	₩ 0-0	0-0	0-0	0-0	Q-6
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	#	=	Ŧ	#
表 - 2 (5	R5	-CH2CH2SCH3	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-CH ₂ OC (CH ₃) ₃	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃
	R4	. #	# -	Н-	7
	R 1				
	化合物番号	845	846	847	848

	V 0-0	0	0 -0		
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	푸		7	Ŧ
表 - 2 (つ	R5	-сн20сн2	-CH ₂ 0CH ₂	-CH ₂ OH	-СН ₂ ОН
	R4	7	Ŧ	Ŧ	#
			0==0		0=\$=0
	化合物番号	849	820	851	852

	(_A)	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH3 00
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	H-	н-	H-	Ŧ
表 - 2 (つ	R5	H-	H -	-CH ₃	-CH ₃
	. R4	H-	#	Ħ-	7
	.R.I				
	化合物番号	853	854	855	856

	¥ -0	£ -	CH3	E 0	£ 0-0
	R7	CH ₃	CH3	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	#	#	Ŧ	Ŧ
表 - 2 (5	R5	-CH2CH2CH3	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-СН(СН ₃)2	-СН (СН ₃) ₂
	R4	Ŧ	Ŧ	Ŧ	
	. R.		0=0=0		0==0
	化合物番号	857	828	829	9860

			· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·		_r — — — — — — — — — — — — — — — — — — —
	(A) 00	CH3 0	CH ₃	CH ₃	E B -0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	#	#-	#-	Ŧ
表 - 2 (7	R5	-CH2CH2CH3	-CH2CH2CH3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R 4	#	н-	H-	#
	R1			. H-	H_3C 0 H_3C 0
	化合物番 号	861	862	863	864

	€ 0	E	CH3	CH3 O0	£ ~
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	#	н-	Ŧ	*
表 - 2 (2	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R 4	# "	7	#-	H-
	. R				
	化合物番号号	865	866	867	898

	(A)	CH3 0-	CH ₃	CH3 0-	CH3 00
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	.	H-	H-	7
表 - 2 (つ	R5	-СН2 СН (СН3) 2	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂	-CH ₂
	R4	#-	#-	#-	Ŧ
	R1	- d-			-s-0
	化合物番 号	698	028	871	872

		E	CH3 O	£ 0-0	£ 0-0
•	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	#	-	F.	7
表 - 2 (2	R5	-CH2CH2SCH3	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-CH ₂ OC (CH ₃) ₃	-сн ₂ ос (сн ₃) ₃
	R4	7	干	干	=
	R 1		0==0		
	化合物番号	873	874	875	876

	₩ <u></u> -0	CH3 0	CH3 0-	CH3	CH3
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	. .	Ŧ	7	#-
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ OH	-сн ₂ он		
	R4	7	H -	H-	#
	R.1				
	化合物番 号	877	878	879	880

	A 0 -0	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃ O-	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃ 0-
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(ラブき)	R6	#	₹ .	Ŧ	7
表 - 2 (つ	R5	;	# -	-CH3	-CH3
	R4	7	Ŧ	干	Ŧ
	R 1		0==0		0==s=0
	化合物番号	881	882	883	884

	(A) 00	H_3C CH_3 $O-1$	H_3C CH_3 O	H_3C CH_3 O	H_3C CH_3 C CH_3 C CH_3
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	RG	Ŧ	#	# :	#
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	-CH(CH ₃) ₂
	R4	н-	7	н-	H
	R 1				
	化合物番号	882	988	887	888

	₩	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃ 0-	H ₃ C CH ₃
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	Ŧ	*	#-	Ŧ
表 - 2 (2	R5	-ch2ch2ch2ch3	-CH2CH2CH3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	H-	=	Ŧ	₹
	- W		0==0	-H	H ₃ C \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \
	化合物番号	688	068	891	892

	(A) 00	H_3C CH_3 O	H_3C CH_3 O	H_3C CH_3 C	H_3C CH_3 O
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	· Ŧ	∓ '	=	. ∓
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R4	F-	7	H-	Н-
	R 1		F 0 0		$\mathbb{A}^{\mathbf{Br}}$
-	化合物番号	893	894	895	968

	A -0	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃ 0-	H ₃ C CH ₃ 0-	H ₃ C CH ₃
	R7	CH3 0	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	Ŧ	Ŧ	7	Ŧ
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	=	#	Ŧ	=
	 Ox	H ₃ C	CH ₃ 0	H ₃ C 0	H ₃ C / H ₃ C 0
	化合物番号	897	868	668	006

	A 0-0	H ₃ C CH ₃	H_3C CH_3 O	H_3 C H_3 0-	H ₃ C CH ₃
	R7.	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(ラづき)	R6	Ŧ	Ŧ.	#	Ŧ
表一名(つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R4	Ŧ	#	H-	7
	R1				
	化合物番号	. 901	805	903	904

	₩ 0 0	H_3C CH_3 O	H_3C CH_3 O	H_3C CH_3 O	H ₃ C CH ₃
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	Ŧ	н-	H-	Ŧ
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	H-	#	Н-	7
	R1		H ₃ C	CH ₃ 0 CH ₃ 0 CH ₃ 0	CH ₃ 0 CH ₃ 0 CCH ₃
	化合物番号	902	906	907	806

	<u>,</u>	_ 			
	(A) 0-	H_3C CH_3 O	H ₃ C CH ₃ 0-0	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	7	#-	+	7
表一名(つ	R5	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	. #	7	Ŧ	Ŧ
	Ri		P 0	P 0	P 0
	化合物番号	606	910	911	912

	₩ \ -0	H ₃ C CH ₃			
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(コンさ)	RG	· #-	#	Ħ	Ŧ
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-сн ₂ сн (сн ₃) ₂
	R4	Ŧ	#	Н-	干
	R 1		200	#5 0	H ₃ C
	化合物番号	913	914	915	916

	(A)	H ₃ C CH ₃			
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	7	7	#	=
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂
	R4	# -	#	#	H-
	Ri	CF ₃ 0	F ₃ C	CH ₃ 0	CH ₃ 0
	化合物番号	917	918	919	920

	∀ 0-0	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃ 0-	H ₃ C CH ₃
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(ラブき)	R 6		#	. # :	H
表 - 2 (5	R5	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	Ŧ	Ŧ	Ŧ	Ŧ
	R.1	Z.			
	化合物番号	921	925	923	924

	(A) 00	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	Re	Ŧ	7	₹	.7
表 - 2 (7	R 5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂
	R4	=	#-	#-	푸
,	R.1	$\langle s \rangle$	0 H ₃ C-S- 0	H_3c \downarrow H_3c \downarrow H_3c \downarrow	0===0
- -	化合物番 号	925	926	927	928

	\ 0-0	H_3C CH_3 O	$H_3C \overset{CH_3}{\overbrace{0^-}}$	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃
	R.7	СН3	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	Н-	Н-	H-	Ŧ
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R 4	7	Ŧ	Ŧ	Ŧ
	R.1	0=0	C1 - S - 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0	Br - S - 0 0 0 0	H ₃ C S 0
	化合物番号	626	930	931	932

	√° -0	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃
	R7	CH ₃	CH3	CH ₃	CH ₃
(つづき)	 9	₹	*	平	Ŧ
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂
	R4	н-	#-	H-	7
	R1	$H_3C \xrightarrow{CH_3} 0$ $CH_3 0$ $CH_3 0$	$\begin{array}{c} H_3C \\ H_3C \\ \end{array} \longrightarrow \begin{array}{c} 0 \\ \vdots \\ 0 \\ \end{array}$	$CH_30 \longrightarrow \begin{bmatrix} 0 \\ \\ \\ 0 \end{bmatrix}$	0 ₂ N 0
	化合物番号	933	934	935	936

	A) 00	H_3C CH_3 O	H_3C CH_3 O	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	Ŧ	=	#	H-
表 - 2 (2	RS	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	Ŧ	푸	Ŧ	¥
	ox 1	0=\subseteq 0	0 = -S = 0		
	化合物番号	937	938	939	940

	(A) 0-0	H ₃ C CH ₃			
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	· #-	H-	Ŧ	Ŧ
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ -	-CH ₂ -	-CH ₂ -	-CH ₂ -
-	R4	#	H-	#-	#
	R I	H-	H_3C H_3C 0		
	化合物番号	941	942	943	944

	V	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃ 0-
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	. 9 W	=	#	Ŧ	Ŧ
表 - 2 (7	R5	-CH ₂ -	-CH ₂ -	-CH ₂	-CH ₂
	R4	#	Ŧ	H-	
	R i		H ₃ C 0 0	CH ₃ 0 CH ₃ 0 CH ₃ 0	
	化合物 番 号	945	946	947	948

	(A) 0-	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	Ħ-	#-	Ŧ	H-
表 - 2 (5	R5	-CH ₂ -	-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂
	R4	H-	н-	н-	7
	R 1		CH ₃ 0 Ch	CH ₃ 0 CH ₃ 0 CH ₃	
	化合物番 号	949	950	951	952

	A)	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃ 0-	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	#	F .	7	7
表 - 2 (2	R5	-CH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -	-CH ₂ -
	R4	#-	Ŧ	Н-	푸
	1 A	- A		g. 0	F ₃ C
	化合物 母 号	953	954	955	926

	₩ - 0	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R.6	=	7	#	Ŧ
表 - 2 (元	. R5	-cH ₂	-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂
	R4	7	#	#	-
	R 1	0 H ₃ C-S- 0		P - S - 0	$CH_30 \longrightarrow \begin{bmatrix} 0 \\ \\ \\ 0 \end{bmatrix}$
	化合物番 号	957	928	929	096

	\$	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃ 0-
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	*	#	#	Ŧ
表 - 2 (5	R5	-cH ₂	-CH ₂ -CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃
	R4	=	Ŧ	#-	Ŧ
	R.I		0=0=0		
,	化合物番号	961	362	963	964

	(A) 0-0	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	н-	H -	7	F
表 - 2 (5	R5	-сн ₂ ос (сн ₃) ₃	-сн ₂ ос (сн ₃) ₃	-сн20н	-сн ₂ он
	R 4	H-	7	7	7
	R1				0=\$=0
	化合物番号	965	996	967	896

	v -0 -0	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	~	
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	7	#	Н-	Ŧ
表 - 2 (7	R5			H-	Н-
	8 8	7	Ŧ	干	7
,	- a		0==0		
	化合物番号	696	970	971	972

		,			
	₩ ³ -0	~ ÷	~-ċ	~	~-
	R7	CH3 0	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	Re	푸	7	· ==	Ŧ
表 - 2 (5)	R5	-CH ₃	-CH3	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-CH2CH2CH3
	R4	H-	#	H-	Ŧ
	Rí				
	化合物番号	973	974	975	976

		<i></i> 0	<i>(</i> -0	/-Q:	∠ 0;
				~ - 	
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	#	#	#	干
表 - 2 (7	R5	-CH(CH ₃) ₂	-СН (СН ₃) ₂	-CH2CH2CH3	-CH2CH2CH3
	R4	#-	7	Ŧ	4
	۳.		0===0		0===0
	化合物番 号	977	978	979	086

	00	~ ·	~-		
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(ラブき)	R6	#	· #	#	#
表 - 2 (5	R 5	-СН ₂ СЙ(СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R 4	Ŧ	H-	#	7
	R.1	H-	H_3C H_3C 0 H_3C 0		
	化合物番号	186	985	983	984

	, o	0-6	— d	00	~-b
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	Ŧ	H -	7	H-
表一2(つ	R5	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	H-	# .	Ŧ	Ŧ
	R1			H ₃ C	CH ₃ 0 CH ₃ 0 CH ₃
	化合物 番 号	982	986	987	886

	(A) 00		~	~-b	~-
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	7	#	F	=
表一2(つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-сн ₂ сн (сн ₃) ₂
	R4	#	7	Ŧ	Ŧ
	Ri	H ₃ C \rightarrow 0	H ₃ C H ₃ C 0		
:	化合物番号	686	066	166	892

	₽	~-b	~- ÷	~-b	~-b
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	Ŧ	#	Ŧ	Ŧ
表一2(2	R5	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	7	Ŧ	H-	Ŧ
	. R. I				H ₃ C H
	化合物番号	993	994	995	966

	. 0 - 0	0 -0		~	
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	7	Ŧ	7	干
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂
	R4	н-	Ħ-	#-	*
	R1	CH ₃ 0 CH ₃ OCH ₃	H N N N N N N N N N N N N N N N N N N N		~ d
	化合物番号	266	866	666	1000

	W -0	~~ b	~-b	~-b	~ o
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	Ŧ	#	#	*
表 - 2 (5	R5	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	#	Ŧ	H-	7
	1.24) D	50	CI
	化合物番号	1001	1002	1003	1004

٠	₩		~-b	<u>-</u> -	~-ċ
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つつき)	R6	¥	Ŧ	Ŧ	₹
表 - 2 (7	R5	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R 4	Ŧ	H-	#-	#
	R1	CH ₃ 0	H ₃ C	CF ₃ 0	P ₃ C
	化合物番号	1005	1006	1007	1008

	~ °	~~-	~- o	~-	00
•	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
表 - 2 (つづき)	₩.	#	F	Н-	#-
	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R4	H-	Ŧ	7	H-
	- C	CH ₃ O	S. 0. 0. 0. 0. 0. 0. 0. 0. 0. 0. 0. 0. 0.		
	化合物番号	1009	1010	1011	1012

	(A) 0-	~-•	<u></u>	~- d	<u></u>
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	#	푸	Ŧ	÷
表 - 2 (石	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂
	R 4	7	Ŧ ′	Ŧ	Ŧ
	R1	N 0		S	H ₃ C-S-
	化合物番号	1013	1014	1015	1016

	W -0	~ d	~ ÷	~- d	~~ ·
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R 6	H	7	· ;	Ŧ
表 - 2 (2	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R4	7	Ŧ	Н-	F
÷		H ₃ C = H ₃ C = 0	0=0=0	P = 0	
	化合物番号	1017	1018	1019	1020

	(A)	— d	0-0	~	~-
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	H-	푸	7	Ŧ
表一2(つ	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	#-	#	Н-	7
	Ri	$\operatorname{Br} \longrightarrow \operatorname{S-}_{0}^{0}$	$H_3C \longrightarrow \begin{bmatrix} 0 \\ \parallel \\ 0 \end{bmatrix}$	$H_3C \xrightarrow{CH_3} \begin{matrix} CH_3 & 0 \\ \vdots \\ CH_3 & 0 \end{matrix}$	H_3C H_3C H_3C 0 0 0 0 0 0 0 0 0 0
	化合物番号	1021	1022	1023	1024

			表 - 2 (5	(つづき)		
化合物番号	R 1	R4	R5	R6	R7	₩ ⁰ -0
1025	CH ₃ 0 CH ₃ 0	平	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	#	CH ₃	~-b
1026	0 - S - N ² 0	Ŧ	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	Н-	CH ₃	~-ċ
1027	0 	Ŧ	-CH2CH(CH3)2	#	CH ₃	~-b
1028	0=\s_\n^2	Ŧ	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	#	CH ₃	~

	₽		0-0	0-0	00
	. R7 .	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	Ŧ	#	Н-	Ŧ
表 - 2 (5	R 5	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2	-cH ₂	-cH ₂
	R4	H-	#-	н-	Ŧ
	R 1	0=\sum_{0}^{N}		Н-	H ₃ C 0 18 H ₃ C 0
	化合物番号	1029	1030	1031	1032

	(v) -0 (00	0-0	
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	#	Ŧ	н-	· н-
表 - 2 (つ	R5	-CH ₂ -	-CH ₂ -	-CH ₂ -	-CH ₂ -
	R4	#	#-	Н-	H-
	R 1				
	化合物番号	1033	1034	1035	1036

	∀	0-0		~-b	~-
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	#-	Н-	7	+
表一2(つ	R5	-CH ₂ -	-CH ₂ -	-CH ₂ -	-CH ₂ -
	R4	#	H-	#	н-
	R.1	CH ₃ 0 CH ₀			CH ₃ 0 CH ₃ 0
	化合物番 号	1037	1038	1039	1040

	₩ - 0		~-b	~	
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	E 0 €
(つづき)	R6	#	#-	7	Ŧ
表 - 2 (元	R5	-CH ₂	-cH ₂	-CH ₂	-CH ₂
	R4	H -	Ŧ	Н-	Ŧ
	R.1	CH ₃ 0 CH ₃		~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~ ~	
	化合物 番 号	1041	1042	1043	1044

	₩,	-	<u></u>	~÷	~-
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	#	#	H-	Ŧ
表 - 2 (~	R5	-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂ -
	R 4	7	Ŧ	7	Ŧ
	R 1	œ œ.	F ₃ C	H ₃ C-S-	0=0=0
	化合物番 号	1045	1046	1047	1048

	Q-0	~- o	~ ÷	~-b	
	R7	CH3 0	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	#	#	#-	
表 - 2 (5	R5	-cH ₂	-CH ₂ -	-CH ₂ -	-cH ₂
	R 4		Ŧ	Ŧ	Ŧ
	1. 24	0=5=0	CH ₃ 0 S - S - O		
	化合物番号	1049	1050	1021	1052

		<u> </u>	<u> </u>	T	T
	₩ } •	~-b	~-	~	
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	Ŧ	H-	7	H-
表 - 2 (2	R5	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-CH2CH2SCH3	-сн ₂ ос (сн ₃) ₃	-сн ₂ ос (сн ₃) ₃
İ	R4	H-	7	7.	#
	R.1		0==0 0==0		0===0
	化合物番 号	1053	1054	1055	1056

	€\$-	~-b	~-b	~-	~ ÷
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	R6	Ŧ	#-	Ŧ	* * .
表 - 2 (5.	R5	-сн2он	-сн ₂ он		
	R4	Ŧ	干	Ŧ	Ŧ
	-24		0==0		
	化合物番号	1057	1058	1059	1060

	∀ -0	0-6	0	0-0	o
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
表 - 2 (つづき)	R6	-02°H)	±	7	±
	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R4	+	-02°но	CH3CO-	-03°НЭ
	R1				P = 0
	化合物番号	1061	1062	1063	1064

	A	Ç-6	0-6	0-0	Ç-6
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
(つづき)	% 9	±	±	+	±
表 - 2 (つ	R5	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ -	-CH ₂
	R4	-02°H)	CH3CO-	CH3CO-	-02°н2
	R1	H ₃ C \longrightarrow 8-	CH ₃ O CH ₃ O		0===0
	化合物番号	1065	1066	1067	1068

		,	T		
·	₩ <u></u>	<u></u>	<u></u>	-6	-6
	R7	CH ₃	CH ₃	S. S. C. S. S. C. S. S. C. S. S. C. S.	CH ₃ CH ₃
表 - 2 (つづき)	R6	±	土	Ŧ	#
	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂
	R4	CH3CO-	СН3СО-	H-	Ŧ
	R 1				
	化合物番号	1069	1070	1389	1390

			表 - 2 (2	(つづき)	·	
化合物番号	- oz	R 4	R5	R 6	R7	V 0-0
1391		Ŧ	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	#	CH ₃ CH ₃	- 0
1392	H ₃ C 0 0	Ŧ	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	₽-	CH ₃ CH ₃	
1393	>- •	. #	-CH2CH(CH3)2	*	CH3 CH3	°-6
1394	H ₃ C	Ŧ	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	7	CH ₃ CH ₃	0-0

	~	0	○ -6	~ -6	Ç-6
	R7	CH ₃ CH ₃	CH ₃	CH ₃ CH ₃	
表 - 2 (つづき)	R6	Ŧ	7	#	푸
	R5	-CH2CH(CH3)2	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R4	Ŧ	Ŧ	#-	#
	R 1	H ₃ C CH ₃	H_3C H_3C H_3C 0	$\begin{array}{c} H_3C \\ H_3C \\ \end{array}$	$\begin{array}{c} H_3C \\ H_3C \\ \\ H_3C \\ \end{array}$
	化合物番号	1395	1396	1397	1398

	OH OH			O HO	O HO
	R6	#-	н-	н-	#-
易合)	. R5	H-	-cH ₃	-CH2CH2CH3	-сн(сн ₃) ₂
(n=1の場合)	R4	H-	Н-	4-	#-
表 - 3 (n=	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R2	H-	H-	H-	#
	R.1				
	化合物番号	1071	1072	1073	1074

	HO HIO	○ -8	○ -#	○ -8	○ -8
	R 6	H-	H-	#	#
	R5	-CH2CH2CH3	CH2CH(CH3)2	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
(っつづき)	R4	Ŧ	. #	H-	#
表 - 3	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-сн ₂ сн (сн ₃) ₂
	R2	Ŧ	7	#	7
	R1				0 = S = 0
	化合物番号	1075	1076	1077	1078

	€	-E	○ _€	○ -5	~ =
	9 X	₹	7	Ŧ	*
. (R5	-CH ₂ -	-ch ₂ ch ₂ sch ₃	-CH ₂ OH	
(つづき)	R4	Ŧ	Ŧ	#-	7
被 「 3	R3	-СН ₂ СН(СН ₃) ₂	-сн ₂ сн (сн ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	Ŧ		# -	H-
	- a				
	化合物番号	1079	1080	1081	1082

	HO HO		0 #6		- H5
	R6	H-	H-	н-	н-
	. R5	# -	-CH3	-CH ₂ CH ₃	-CH2CH2CH3
(つづき)	R4	#-	#-	#-	Ŧ
表 - 3	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R2	#-	Ŧ	7	Ŧ
	R 1				
	化合物番号	1083	1084	1085	1086

	₩ SH	- H5	○ -5	0 50	©≅
-	R6	Ŧ	Ŧ	푸	Ŧ
	R5	-Сн(Сн ₃) ₂	-CH2CH2CH3	-CH CH ₃	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂
(つづき)	R4	#	Н-	7	H-
表 - 3 (R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	#
	R2	Ŧ	#	7	Ŧ
	1.2				
٠	化合物番号	1087	1088	1089	1090

	₩ N	- E	- E	- E	
	Re	=	=	#-	Ŧ
(3	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
(つづき)	π 4	Ŧ	H-	#-	Ŧ
表 I 3	R3	-CH ₃	-CH2CH2CH3	-сн(сн ₃) ₂	-CH ₂ CH ₂ CH ₃
	R2	Н-	7-	#	. 7
	R.1				
	化合物番 号	1001	1092	1093	1094

	€	-5	0 15	0 H5	0 ■
	86	Ŧ	7	Ŧ	Ŧ
	7 6	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂
(つづ巻)	R4	Ŧ	#-	н-	#-
表 - 3	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	#	#	#	-СН3
	RI	Ŧ	H ₃ C 0 H ₃ C 0		
	化合物番号	1095	1096	1097	1098

	₩ SE	- E	0 = 5	0 E	- E
	R6	=	-CH3	#-	7
. (a)	RS	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
(つづき)	R4	-сн3	Ŧ	Ŧ	#
表 I 3	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂
	R2	н-	7		. #
	R 1				
	化合物番号	1099	1100	1101	1102

					
	€	- H	- TO		0 H
	R6	7	7	#-	Н-
	RS	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-Сн ₂ СН (СН ₃) ₂
(つづき)	R4	#	н-	н-	#
表 - 3	R3	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	#-	#	H-	#-
	R I	H ₃ C \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	CH ₃ 0		
	化合物番号	1103	1104	1105	1106

	R6 (A)	#-	H-	□ □ □	0 H-
نۆد (R5	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	² (8н))но ² но-	-сн ₂ сн (сн ₃) ₂	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂
(つづき)	R4	Ŧ	7	7	7
表 - 3	R3	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂
	R2	7-	#-	7	· 주
	R 1	H ₃ C \(\sqrt{1}	CH ₃ (CH ₂) ₁₂		
	化合物番号	1107	1108	1109	1110

	A OH	E		O H	○ -8
	R6	#-	H-	Н-	-Н
(R S	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН 3)2
(つづき)	R4	7	н-	Н-	Ŧ
ا ا ا	RS	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	干	=	H-	#-
	. R.	OCH ₃	CH ₃ 0 CH ₃ 0		
	化合物番号	1111	1112	1113	1114

	₩ H	- E	-B	0 5	○ -5
	۳. ه	Ŧ	=	Ŧ	干
	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
(つづき)	R4	=	Ŧ	H-	Ŧ
表 - 3	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	н-	11 -	#-	Ŧ
	R 1	P 0	P 0	0 0 0	H³c O
	化合物番号	1115	1116	1117	1118

	R6 OH	0 H-	H-	0 H-	- H
		-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН 3)2
(つづき)	R4	=	н-	F	# -
表 - 3	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	H-	н-	H-	#-
	R1	CH ₃ 0	CH ₃ 0 0	H ₃ C \ 0 \ H ₃ C \ H ₃ C \ 0 \ 0 \ 0 \ 0	Z=0
	化合物番号	1119	1120	1121	1122

	HO HO	OH HO	OH OH	OH OH	OH OH
	R6	H-	Н-	н-	#-
)	* - ∫ × ;	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
(つづき)	R4	#-	Н-	Н-	#
表 - 3	R3	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН 3)2	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂
	R2	#	#-	۳	JH-
	R1			0 	
	化合物番 号	1123	1124	1125	1126

•

					6
	V O HO	E HO		E E	₩ H
	R6	H-	Ŧ	Н-	H-
(RS	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	² (°н) СН ² СН (СН ³)
(つづき)	R4	H-	H-	#-	H-
版 I	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2		Ŧ	H-	Н-
·	R1	0===0		H_3c C	H ₃ C CH ₃ 0 S - S - CH ₃ 0 CH
	化合物番号	1127	1128	1129	1130

					
	₩	- E	-E		
	R 6	#-	#-	#	Ŧ
* j.**		-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
(つづき)	R4	7	Ŧ	₹	Ŧ
被 - 3	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-сн ₂ сн (сн ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	н-	#-	H-	7
	R1	$CH_30 \longrightarrow \begin{bmatrix} 0 \\ \\ \\ 0 \end{bmatrix}$		0=%=0	0=\$=0
	化合物番号	1131	1132	1133	1134

					•
	₩ 5	-B	0 -5	- E	O H
	R 6	7	Ŧ	푸	Н-
i Sugark	SC CC	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-сн ₂ сн (сн ₃)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН 3)2
(つづき)					
0,	R4	#	7	#	F
表 I 3	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃
	R2	Ŧ	#-	#	Ŧ
	12	0=0	0=0=0		
	化合物番号	1135	1136	1137	1138

		· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·		
	₩	- 5	-5-E	-5-E	- E
	9 %	7	#-	Ŧ	F
	8 X	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂
(つつる)	R4	Ŧ	7	Ŧ	Ŧ
د (کا ا	R3	-CH ₂ OC (CH ₃) ₃	-сн ₂ он		#-
	R2	н-	#	Ŧ	7
	R.1				
	化合物番 号	1139	1140	1141	1142

. 3 (),

	€	0-80	O #5	- HO	0 40
	R 6	Ŧ	Ŧ	=
agi sup fina		-GH ₂	-CH ₂ -C	-cH ₂	-CH ₂ -
(つづき)					
$\begin{bmatrix} \tilde{c} \\ J \end{bmatrix}$	R4	۳	+	H-	#
表 - 3	R3	-CH ₃	-CH2CH2CH3	-СН(СН ₃) ₂	-CH2CH2CH3
	R2	7	Ŧ	Ŧ	Ŧ
	R1				
	化合物番号	1143	1144	1145	1146

	HQ OH	0 HO	NO HO	0 H5	NO HO
	R6	7	7	-#	=
·	Marketin sections.	CH ₂	CH ₂ -CH ₂	CH ₂	CH ₂
(つづき)	R4	н-	H-	H-	Ŧ
表 - 3	R3	-CH CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	H-	7	Ŧ	7
	R 1				
	化合物番号	1147	1148	1149	1150

	A			- H	- H
	R6	7	7	Ŧ	#
	R S	-cH ₂ -C	-CH ₂ -	-cH ₂	-CH ₂ -
(つづき)	R4	=	H-	F.	- H
表 - 3 (4	R3	-CH2CH(CH3)2	-ch ₂ ch ₂ sch ₃	-сн ₂ он	
	R2	Ŧ	7	H-	Ŧ
	. R1	0===0			
	化合物番号	1151	1152	1153	1154

			,	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	
	₩ OHD	0 #5	- E	0 = 5	0 =
	84	Ŧ	#	Ŧ	₹
े ज्वेत्त्वस्य स्थल इंड. ज्वेत्वस्य	8	CH2 CH2 SCH3	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-CH ₂ OH	-CH2OH
(コンき)	R4	7	*	Ŧ	#
$\widehat{\mathcal{L}}$		<u>'</u>	,	•	'
表 - 3	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	н	н-	Ŧ	7
	R.1		0==0		0=\$=0
	化合物番 号	1155	1156	1157	1158

	A Dep	o _5	OHO HO	E S S S S S S S S S S S S S S S S S S S	CH ₃	
	R 6	. Ŧ	. 7	7	н-	
on and and	8				-CH ₃	and the second of the second o
(つづき)	R4	7	7	#	Ŧ	
表 - 3 (R3	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	·
	R2	#	Ŧ	₹-	7	
	R1		0===0			
	化合物番号	1159	1160	1161	1162	

		O HO	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
		R6	н-	н-	H-	7
	er Mer	R5	-CH2CH2CH3	-CH(CH ₃) ₂	-CH2CH2CH3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
*	(つづ巻)	R4	Ŧ	Ŧ	Ŧ	Ŧ
•	ſ	R3	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂			
		R2	Ŧ	#-	7	¥
		Rì				
		化合物番 号	1163	1164	1165	1166

•	(A) OHO	H_3 C CH_3 OH	H ₃ C CH ₃	$H_3 C \xrightarrow{CH_3} 0$	$H_3^{C} \xrightarrow{CH_3} 0$	
	R6	H-	-11	7	· #	
	R5	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂	-CH2CH2SCH3	
(つ (対 (対	R4	7	7	#-	н-	
# Ķ I	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	•			
	R2	F	Ŧ	H-	7	
	- ex		0=%=0			
	化合物番号	1167	1168	1169	1170	

and the control of th

	A HO	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃ OH		~====================================
	R6	Ŧ	7	#	Ŧ
	RS	-CH ² OH			CONTRACT
つつ、参	R4	7	7	· #	Ŧ
±¢ ⊢	R3	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂
	R2	7	#	7	==
	R 1				
	化合物番号	1111	1172	1173	1174

	V de	~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~	~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~	~~=	~~=
	86	푸	Ŧ	=	7
	S W	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	-CH2CH2CH3
かって	R4	7	Ŧ	=	#
表 · 3	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	7	Ŧ	#	H -
	化合物番号	1175	1176	1177	1178

	OH OH	~ E	~ =		
	R6	H-	н-	Ŧ	Ŧ
and a second of the second Spanish second of the second of	K2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2
(カンガル) (か)	R4	Ŧ	=	푸	Ŧ
#₹ ι &	R3	-Н	-CH ₃	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₃
<i>:</i>	R2	Ŧ	7	Ŧ	7
	R I				
	化合物番号	1179	1180	1181	1182

_				т	
	₩			~~=	
	R6	7	#-	=	##
)	S M Mariana (Mariana)	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
(ラづき)	R4	#	н-	H-	#
表 - 3 (R3	-сн(сн ₃) ₂	-CH2CH2CH3	-СН ₂ СН (СН ₃) 2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	Ŧ	#	7	#-
				Ŧ	H ₃ C 0 H ₃ C 0
	化合物番号	1183	1184	1185	1186

	V OH	~ = 5	~=====================================		
	R6	Ŧ	7	7	#
es empe	R 5	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
(つづき)	R4	H-	н-	H-	7
表 - 3	R3	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	¥	#-	#-	Ŧ
	R.1			CH ₃ 0 CH	
	化合物番号	1187	1188	1189	1190

estagen sages de la company

	V OHO	~ =	OH HO		~ 5
	Re	#	#	#	F
	R S	-сн ₂ сн (сн 3)2	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-сн ₂ сн (сн ₃) ₂
つつが	R4	H-	Ŧ	Ŧ	Ŧ
₩ 	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂
	R2	*	₹	Ŧ	H-
	R1	H ₃ C			CH ₃ 0 CH ₃ 0 OCH ₃ 0
	化合物番号	1191	1192	1193	1194

	V S ≡		~==		
	R6	7	Ŧ	Ŧ
	RS	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂
(つづき)	R4	#	н-	H-	Н-
表 - 3	R3	-CH ₂ CH (CH 3)2	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂
	R2	н-	#	7	#
	R.I			H ₃ C	CH. O. CH.
	化合物番号	1195	1196	1197	1198

	₩ OH	- 0 = =	- C	_ #	~=====================================
	R6	Ŧ	7	H-	Ξ.
	R 2	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH(CH ₃) ₂
(つづき)	R4	Ŧ	H-	#-	#
表 - 3	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	Ŧ	7	Ŧ	Ŧ
	1 24	H3C - 0	0==0	0=5=0	H ₃ C CH ₃ 0 CH ₃ 0
	化合物番号	1199	1200	1201	1202

		l		· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	1
	₩ [™]		~=====================================	~=====================================	~=====================================
	% 9	H-	#	#-	*
and the second of the second o	B 2	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2
- Mo					
(つづき)	R4	"	H-	7	푸
表 - 3	R3	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-сн ₂ ос (сн ₃) ₃	-сн ₂ он
	R2	Ŧ	Ŧ	Ŧ	7
	e				
	化合物番号	1203	1204	1205	1206

	HO OH	~=====================================	_e_=	~ <u>~</u> =	~ 5
	R 6		Ŧ	干	=
Nag.	8 8 1,455,454,454,454	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-cH ₂ -	-cH ₂	-CH ₂ -
(つづき)	R4	=	H-	#	Ŧ
表 - 3 (R³		H	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₃
	R2	# -	#	#	н-
	R.1				
	化合物 电 电	1207	1208	1209	1210

	HO HO		~ =			·
	R6	#	=	#	Ŧ	
	R5	-cH ₂ -	CH ₂ -CH ₂	-cH2-	_cH ₂ _	
(プングル) (地)	R4	H-	H-	Н-	Н-	
#Ķ ≀ &	R3	-сн(сн ₃) ₂	-CH2CH2CH3	-CH CH3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	
	R2	7		#	-	
	R1					
•.	化合物番 号	1211	1212	1213	1214	

	₩ H	~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~			
	R6	7	=	-#	₹ .
)	B S	-cH ₂ -	-cH ₂	-cH ₂ -	-CH ₂ -
(つづき)	R4	#	#	#-	#-
表 - 3 (R3	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃
	8 2	Ŧ	Ŧ		H-
	1.8			0===0	
	化合物番号号	1215	1216	1217	1218

	₩ W	~ =	~==	~= =	~~~ 5
	, R 6	Ŧ	7	Ŧ	7
	R5	-cH ₂ -	-cH ₂	-CH2CH2SCH3	CH2CH2SCH3
(つづき)	R4	H-	#-	7	Ŧ
表 - 3	R3	-CH ₂ OH		-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	₹	푸		Ŧ
	۳. ا				0=0
	化合物番 号	1219	1220	1221	1222

· ·

	₩ 5	~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~	~~=		
	86		#-	H-	7
(S	-сн ₂ он	-сн ₂ он		
(つづき)	.R4	Н-	н-	#	H-
表 - 3 (R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R2	Ŧ	=	7	7
	R 1		0=\$=0		-S-0
	化合物番号	1223	1224	1225	1226

	(A)	0-0	0-0	• o	○
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R6	н-	#	н-	H -
(n=1の場合)	R5	#	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-CH(CH ₃) ₂
u)	R4	н-	#	н-	#-
表 - 4	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R2	H-	#	н-	н-
	R1				
	化合物番号	1227	1228	1229	1230

	v - 0	~		Ö-6	Ö
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R6	н-	н-	H-	
(つづき)	KS	-CH2CH2CH3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
\widehat{L}	R4	H-	н-	H-	#-
表一4	ಜ	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-сн ₂ сн (сн ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	Ŧ	#	н-	#-
	. R. I				0=\$=0
	化合物番 号	1231	1232	1233	1234

	A -0	0-0	0 -0	0-0	° -0
	R7	СН3	СН3	EH3 CH3	CH ₃
	R6	₹	H -	н-	#-
	R5	-CH ₂	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-CH ₂ OH	
$\widehat{\mathcal{L}}$	R4	H-	н-	Ŧ	Ŧ
	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	7	H-	Ŧ	#
	R 1				
	化合物番号	1235	1236	1237	1238

	-0 -0	0-0	0-0	-6	Ö-6
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R6	7	#-	Ŧ	=
(つづき)	R5	=	-CH ₃	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₃
$\overline{\mathcal{C}}$	R4	#		H-	Н-
表 - 4	R3	-сн ₂ сн (сн ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	7	7	H-	#
	R 1				
	化合物	1239	1240	1241	1242

	() -0	0-	\bigvee_{0^-}	0-0	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R.6	H -	#-	푸	Ŧ
(つづき)	R5	-СН (СН ₃) ₂	-CH2CH2CH3	-CH CH3	-CH2CH(CH3)2
\widehat{L}	R4	H-	#-	#-	#
表 - 4	R3	-сн ₂ сн (сн ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-Н
	R ²	Ŧ	н-	#	н-
	R.1				
	化合物番号	1243	1244	1245	1246

:	-0	0-0	0-0	Ç-6	0-
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	RĠ	H -	#-	#-	-11
(つづき).	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
\widehat{L}	R4	н-	н-	н-	-н
表 - 4	S S	-CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₃	-СН (СН ₃) ₂	-CH2CH2CH3
	R2	7		H-	н-
	1 A				
	化合物番号	1247	1248	1249	1250

	(A)	0	0	Ç-6	Ç-0
,	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R6	#-	#	7	H-
(つづき)	. R5	-CH2CH(CH3)2	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
\widehat{L}	R4	# -	#-	Н-	н-
表 - 4	8. 8.	-CH2CH(CH3)2	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	7	7	#	-сн3
	- R	±	H ₃ C 0 KH ₃ C 0		
	化合物番号	1251	1252	1253	1254

	(A) 0-	0-0	0-0	000	0-6
	R. ⁷	СИЗ	СН3	CH ₃	CH ₃
	R6	H -	-сн3	¥-	. =
(つづき)	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
\widehat{L}	R4	-сн3	н-	н-	H-
表 - 4	. R3	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	F	H-	Ŧ	Ŧ
	R.1				
	化合物番号	1255	1256	1257	1258

		·····		
V − 0	~-		-6	
R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
R 6	#	#-	7	#-
RS	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
R4	Ŧ	H-	#-	H-
R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂
R2	#	Ŧ	7	Ŧ
R.1	H ₃ C	CH ₃ 0 CH ₃ 0		
化合物番 号	1259	1260	1261	1262
	R ¹ R ² R ³ R ⁴ R ⁵ R ⁶	$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$

	₩ - 0	0-0	~ ·	Ç-6	~ ·
-	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R6	#-	Ŧ	H-	Ŧ
(つづき)	RS	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
$\widehat{\mathcal{C}}$	R4	7	#	#	Ŧ
表 - 4	. s	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-сн ₂ сн (сн ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	Ŧ	Ŧ	Ŧ	=
	R.	} O U	CH ₃ (CH ₂) ₁₂		
	化合物 番 号	1 🕺	1264	1265	1266

(A) 0-	0-0	0-0	0	
R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
R6	Ŧ	#-	H-	#-
R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
R4	н-	H-	н-	Ŧ
R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
R2	Ŧ	Ŧ	Ŧ	Ŧ
R1	OCH ₃	CH ₃ 0 CH ₃ 0 OCH ₃ 0		
化合物番号	1267	1268	1269	1270
	R^1 R^2 R^3 R^4 R^5 R^6 R^7 C	$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	化合物 R1 R2 R3 R4 R5 R6 R7 CH3 1267 CH30 -H -CH2CH(CH3)2 -H -CH3CH(CH3)2 <	$\frac{(C-65)}{48-5} \qquad R^{1} \qquad R^{2} \qquad R^{3} \qquad R^{4} \qquad R^{5} \qquad R^{6} \qquad R^{7} \qquad \frac{(C-6)}{4} = \frac{1267}{000000000000000000000000000000000000$

1	,				
	₩ -0	Ç-6	Ç-6	Ç-6	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R6	#	Ŧ	H-	=======================================
(つづき)	RS	-сн2сн(сн3)2	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
$\widehat{\mathcal{C}}$	R4	Ŧ	H-	#-	H-
表 - 4	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R ²	*	Ŧ	н-	H-
	R1		CZ CZ.	0 13	H ₃ C
	化合物番 号	1211	1272	1273	1274

	(V)	0-0	0-0	0-0	-0
	R 7	CH ₃	CH ₃	СН3	CH ₃
	R6	#-	H-	₩-	н-
(つづき)	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
\hat{r}	R4	#-	H-	*-	-H
表 - 4	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R ²	#-	н-	#-	7
	R1	CH ₃ 0	CH ₃ 0 OCH ₃	H ₃ C \ \ H ₃ C \ \ \ H ₃ C \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	0 N
	化合物番号	1275	1276	1277	1278

	√° -0			0-6	0-6
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	9	7	Ŧ	Н-	=
(つづき)	S S S	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-сн ₂ сн (сн ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
$\hat{\mathcal{L}}$	R4	н-	+	H-	#
表 - 4	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	#	¥-	H-	H-
	R1			0 	
	化合物番号	1279	1280	1281	1282

			T	Т	
	₩ 0		Ç-6	Ç-6	
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃ CH ₃	
2.	86	#-	Н-	#-	#
(うづき)	RS	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
$\overline{\mathcal{C}}$	R4	H-	н-	н-	Н-
表 4	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	=	æ	H-	н-
	1.8	0=0=0	0=0=0		0===0
	化合物番号	1283	1284	1285	1286

	₩ 0-0	0-0	0-0	0-0	Ç-6
	R7	-CH ₃	-C(CH ₃) ₃	CH ₃	
	R6	н-	H-	#	. .
(つづき)	 R5	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СИ ₂ СИ (СН ₃) ₂
\hat{G}	R4	#-	н-	Н-	H -
表 - 4	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-сн ₂ сн(сн ₃) ₂
	R2		π-	н-	H-
	R.1	-s-0		P - S - 0	
	化合物番号	1287	1288	. 1289	1290

				,	
	₩ -0	-6		-6	~ ÷
	R7	CH ₃)=0	CH ₃	CH ₃
	R6	#-	н-	H-	Ŧ
(つづき)	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
\hat{r}	R4	Н-	#	#	#
表 - 4	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	=	Ŧ	· =	Ŧ
	R 1	H_3c \longrightarrow \vdots	$H_3C \xrightarrow{CH_3} 0$ $H_3C \xrightarrow{H} S -$ $CH_3 0$	$CH_30 \longrightarrow \begin{bmatrix} 0 \\ \\ \\ \\ 0 \end{bmatrix}$	$\begin{array}{c c} & 0 & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ & & \\ &$
	化合物番号	1291	1292	1293	1294

	₩ -0	Ç-6	Ç-6	0-6	
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R6	+	Ŧ	7	#
(つづき)	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-сн ₂ сн (сн ₃₎₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СН ₂ СН (СН ₃) ₂
\hat{C}	R4	Н-	#-	H-	#
表 - 4	R.3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	7	7	7	Ŧ
	R.1	0=0=0	0=0=0		0=0=0
	化合物	1295	1296	1297	1298

					
	-0 0-			_ -6	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R6	н-	#	н-	#-
(つづき)	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
\hat{c}	R4	н-	#-	н-	H-
表 - 4	R3	-CH ₂	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-CH ₂ OC(CH ₃) ₃	-CH ₂ OH
	R2	7	#-	#	H-
	R 1				
:	化合物番号	1299	1300	1301	1302

Г					
	₩\-	Ç-6	Ç-6	~ d	Ç-6
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
ŀ	R 6	7		#-	
(つづき)	RS S	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂
$ \mathcal{C} $	70 4 4	Ŧ	7	н-	H-
表 - 4	R3		# -	-CH ₃	-CH2CH2CH3
	R2	Ŧ	#	7	₹
	R.1				
	化合物番号	1303	1304	1305	1306

				_	_
	$\begin{pmatrix} A \\ 0 \end{pmatrix}$		0		
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R6	#	#-	H-	#
(つづき)	R5	-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂
$\hat{\mathcal{L}}$	R4	#-	н-	Н-	н-
表 - 4	R3	-СН (СН ₃) ₂	-CH2CH2CH3	-CH CH3	-СН ₂ СН (СН ₃)2
	R2	н-	H-	Н-	#
	. R 1				
	化合物番号	1307	1308	1309	1310

ı		T			
	₩ 0-0				~ ·
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	Re	7	7	# -	#
(つづき)	RS	-CH ₂ -	-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂
$\widehat{\mathcal{L}}$	R4	#	H -	н-	#-
表 4	R3	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃
	R2	Ŧ	#	H-	Н-
	. A			-s-0	
	化合物番号	1311	1312	1313	1314

	∀ }	00	0-0	0	0
	R7	CH ₃	CH ₃	СН3	CH ₃
	R6	н-	H-	Н-	н-
(つづき)	R5	-CH ₂	-CH ₂	-cH2cH2scH3	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃
\hat{r}	R4	H-	H-	H-	н-
表 - 4	R3	-CH ₂ OH		-СН ₂ СН (СН ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	н-	н-	н-	#-
	R1				
	化合物番号	1315	1316	1317	1318

		_			
	V		\$\doldsymbol{6}\$	\$-6	\rightarrow 6
	. R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	Re	7	Ŧ	#-	#
(つづき)	R5	-CH ₂ OH	-CH ₂ OH		
\hat{C}	R4	#-	#-	#	=
表 - 4	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R2	7	7	н-	H-
	. R		0=0=0		
	化合物番号	1319	1320	1321	1322

	₩ 0-0	CH 3	CH3 O-	CH ₃	CH3
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	E
	R 6	Ŧ	Н-	7	7
(つづき)	R5	-Н	-CH ₃	-CH2CH2CH3	-сн(сн ₃) ₂
\widehat{L}	R4	н-	#-	#-	Ŧ
表 - 4	R3	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	H-	Ĥ-	н-	Ŧ
	R1				
	化合物番号	1323	1324	1325	1326

	0-0	E	E	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R6	н-	H-	#	F
(つづき)	R5	-CH2CH2CH3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
\hat{C}	R4	Ŧ	#-	#-	H-
嵌-	82	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R2	Ŧ	7	Ŧ	Ŧ
	R 1				0=8=0
	化合物	1327	1328	1329	1330

	(V)	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃	H ₃ C CH ₃
	. R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R6	H-	н-	H-	7
(つづき)	R5	-CH ₂	-CH2CH2SCH3	-сн ₂ он	
\mathcal{L}	R4	Ŧ	#	#-	7
表 - 4	R ³	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-сн ₂ сн (сн _{3) 2}
	R2	F	H-	#	Ŧ
	R 1				
-	化合物番号	1331	1332	1333	1334

	Q-0	~ ·	0-6	~	~ · ·
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	Re	#-	¥	#	7
(つづき)	R5 -	-H	-CH3	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₂ CH ₃
Ĉ	R4	Ŧ	7	7	#
表 - 4	85 85	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R2	Ŧ	Ŧ	Ŧ	
	R1				
	化合物	1335	1336	1337	1338

	(4)		0-0	0-0	0
	R7	CH ₃	СН3	СН3	СН3
	R6	#-	H-	H-	#-
(つづき)	R5	-СН(СН ₃) ₂	-CH2CH2CH3	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH2CH(CH3)2
<i>r</i>	R4	H-	H-		н-
表 - 4	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	₹	-CH3
	R2	H-	#-	Ŧ	H -
	R I				
	化合物番 号	1339	1340	1341	1342

	∀ } 6	/-e, ,	√° ≻•	√° ,-ċ	/ °≻-ċ
			\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\		
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R6	Ŧ	#-	7	Ŧ
(つづき)	RS	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
$\widehat{\mathcal{C}}$	R4	#-	H-	н-	Ŧ
表 - 4	82	-CH ₂ CH ₃	-CH ₂ CH ₃	-CH(CH ₃) ₂	-CH2CH2CH3
	R2	Ŧ	Ŧ	Ŧ	H-
	R.1				>0
	化合物番号	1343	1344	1345	1346

	(A) 0-	00	0-0	0-0	0-0
	R7	CH ₃	CH ₃	СН3	CH ₃
	R6	#-	Н-	H	-H
(つづき)	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂
\hat{c}	R4	#	н-	#-	#
表 - 4	R3	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-СИ ₂ СИ (СИ 3) ₂
	R2	#-	H-	н-	Ŧ
	R1	н-	H ₃ C 0 H ₃ C 0		
	化合物番号	1347	1348	1349	1350

			-		····
	₩ -0	~-o	~- o	~-d	~-
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R6	Ħ.	#-	H-	Ŧ
(つづき)	RS	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
Ĉ	R4	H-	Н-	#-	7
张 一 4	R3	-CH2CH(CH3)2	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R ²	#	н-	н-	T.
	R1	CH ₃ 0		н³с <u>√</u>	
	化合物番号	1351	1352	1353	1354

	1			 1	
	€ 0-0	~- o	~ d	~-	~-o
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	RG	Ŧ	#	H-	H-
(つづき)	RS	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
\widehat{C}	R4	#-	н-	H-	н-
表 - 4	R3	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	푸	#-	н-	н-
	R1		CH ₃ 0 CH ₃ 0		₩ d
	化合物番号	1355	1356	1357	1358

	(A) 0-	-0	-0	0-0	~
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R6	Н-	Н-	Н-	#-
(つづき)	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
\hat{r}	R4	H-	н-	н-	#-
表 - 4	R3	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	н-	7	#	Ŧ
	R1	H ₃ C \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \	CH ₃ 0 0	0 H3C-S- 0	
	化合物番号	1359	1360	1361	1362

	V V V V V V V V V V	~-	~-a	~- ÷	~- à
	R.7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
- 2 - 5	R6	#-	H-	H-	Н-
(コブき)	R5	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
\mathcal{L}	R4	#-	Н-	н-	Ŧ
表 - 4	R3	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃
	R2	#-	#-	н-	# .
	R 1	$F \overset{0}{\longleftrightarrow} \overset{0}{\overset{\parallel}{\Longrightarrow}} \overset{0}{\longleftrightarrow}$	$H_3C \xrightarrow{CH_3} 0$ $CH_3 0$ $CH_3 0$		
	化合物番号	1363	1364	1365	1366

	~°	/-e, ,		√° ≻-ċ	√° ≻-ċ
	€ }				
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R6	#	#	7	#
(つづき)	R5	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-сн ₂ сн(сн ₃₎₂	-cH ₂
$\widehat{\mathcal{L}}$	R4	7	#-	н-	Ŧ
表 - 4	R3	-сн ₂ ос (сн ₃)3	-СН2ОН		H-
	R2	Ŧ	#	== 1	н-
	. R. I				>=0
	化合物番号	1367	1368	1369	1370

	(\ \)	~-b		~-	~- d
	R7	СН3	CH ₃	EH3 CH3	CH ₃
	R6	н-	H -	H-	H-
(つづき)	R5	-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂
\hat{r}	R4	Ŧ	#	#	Н-
·表一4	R3	-CH ₃	-CH2CH2CH3	-сн(сн ₃) ₂	-CH2CH2CH3
	R2	7	Ŧ	Ŧ	Ŧ
	R.1				
	化合物番号	1371	1372	1373	1374

[T				
	₩ -0	~ d	~- o	~ - o	~ ·
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH3
	R6		#-	7	=
(つづき)	R5	-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂
$\widehat{\mathcal{C}}$	R4	Ŧ	#-	Ŧ	#-
表 - 4	R3	-CH CH ₃	-CH ₂ CH (CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	R2	Ŧ	7	Ŧ	
	1.33				
٠	化合物番号	1375	1376	1377	1378

	(A)	~- à	~- d	~-	~ ·
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	G
•	R6	#	H-	7	=
(つづき)	R5	-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂	-CH ₂
\hat{r}	R4	+	#	· +	#
表 - 4	R3	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-СН ₂ ОН	
	R2	7	Ŧ	Ŧ	Ŧ
	. R 1				
	化合物番 号	1379	1380	1381	1382

,			————	 -	
	√ 0-0	~- d	~ ·	~- b	
	R7	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃
	R G	F	Ŧ	#	7
(つづき)	R5	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₃	-сн ₂ он	-CH ₂ OH
$\widehat{\mathcal{C}}$	R4	Ŧ	#-	Н-	Ŧ
表 - 4	82 82	-CH ₂ CH(CH ₃) ₂			
	R2	Ŧ	7	*	=
	R 1	>=0	0=\$=0		
	化合物 番 号	1383	1384	1385	1386

-
R2 R3
-Н -CH ₂ CH(CH ₃) ₂
-н -сн ₂ сн(сн ₃) ₂

次に本発明の化合物の製造法について説明する。上記一般式(I)で表される含酸素複素環誘導体は、例えば次のような方法で製造することができる。

製造法1:R⁷が水素原子である化合物の製造法

(上記一般式において、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、Aおよび n は既に定義した通りである)

上記一般式 (IV) で表されるアミノ酸誘導体を、必要に応じてトリエチルアミン、ピリジン等の塩基の存在下、ジシクロヘキシルカルボジイミド、ジフェニルホスホリルアジド、カルボニルジイミダゾール、オキサリルクロリド、クロル蟻酸イソブチル、塩化チオニル等の縮合剤と反応させてカルボン酸を活性化させ、次に上記一般式 (V) で表されるラクトン誘導体を反応させると、上記一般式 (VI) で表される化合物が得られる。この縮

合反応に用いる溶媒は、各縮合剤に適した溶媒を適宜選んで使用すればよく、また反応条件等も各縮合剤に適した条件で行えばよい。次に得られた化合物(VI)を水素化ジイソプチルアルミニウム、水素化ホウ素ナトリウム/塩化セリウム等の還元剤で処理すると上記一般式(II)で表される含酸素複素環誘導体を得ることができる。

O || 製造法2:R⁷ がR⁸ -C-である化合物の製造法

10
$$R^{1}$$
 R^{3} R^{4} R^{5} R^{6} R^{6} R^{9} R^{9} R^{1} R^{1} R^{2} R^{1} R^{1} R^{2} R^{1} R^{2} R^{1} R^{2} R^{1} R^{2} R^{2} R^{2} R^{3} R^{4} R^{5} R^{6} R^{6} R^{9} R^{9} R^{1} R^{2} R^{2} R^{2} R^{3} R^{4} R^{5} R^{6} R^{9} R^{9} R^{1} R^{2} R^{2} R^{2} R^{3} R^{4} R^{5} R^{6} R^{9} R^{9} R^{1} R^{2} R^{2} R^{3} R^{4} R^{5} R^{6} R^{9} R^{9} R^{1} R^{1} R^{2} R^{2} R^{3} R^{4} R^{5} R^{6} R^{9} R^{9} R^{1} R^{1} R^{2} R^{2} R^{3} R^{4} R^{5} R^{6} R^{9} R^{9} R^{1} R^{1} R^{2} R^{2} R^{3} R^{4} R^{5} R^{6} R^{9} R^{9} R^{1} R^{2} R^{3} R^{4} R^{1} R^{1} R^{2} R^{3} R^{4} R^{1} R^{2} R^{3} R^{4} R^{1} R^{2} R^{3} R^{4} R^{2} R^{3} R^{4} R^{5} R^{5} R^{6} R^{5} R^{5} R^{6} R^{5} R^{5}

(上記一般式において、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R°、R°、A およびnは既に定義した通りである)

20 製造法1により製造した含酸素複素環誘導体を、塩化メチレン、1,2 ージクロロエタン、ジメチルホルムアミド、Nーメチルピロリドン、テトラヒドロフラン、酢酸エチル、アセトニトリル、トルエン等の有機溶媒に溶解し、ピリジン、トリエチルアミン、4ージメチルアミノピリジン等の塩基の存在下、上記一般式(R°CO)2 Oで表される酸無水物を反応させると、上記式(VII)で表される含酸素複素環誘導体を得ることができる。この反応は、無溶媒で行うこともできる。

10

20

製造法 $3:R^{7}$ が $C_{1}\sim C_{5}$ のアルキル基である化合物の製造法

(上記一般式において、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R³、A およびnは既に定義した通りであり、R¹⁰はC₁~C₅のアルキル基を表 す)

15 製造法2で得られた化合物 (VII)を、R¹⁰OHで表されるアルコールに 溶解し、塩酸、硫酸等の酸を触媒量加えて撹拌すると、上記一般式 (VIII) で表される化合物が得られる。

上記の一連の操作において、官能基の保護、脱保護が必要になる場合も あるが、その際の保護基はその官能基に適したものを選択し、実験操作も 文献公知の方法を用いて行えばよい。

かくして得られた本発明の含酸素複素環誘導体のうち、R[†]が水素原子 の化合物(II)は、システインプロテアーゼに対して強い阻害活性を示す。

また、 R^{7} が C_{1} \sim C_{6} のアルキル基の化合物(VIII)および R^{9} - C_{-2} (R^{9} は C_{10} \sim C_{10} のアルキル基または置換基を有していてもよい C_{6} \sim C_{12} のアリール基を表す)の化合物(VII)は、システインプロテアーゼに

対して強い阻害活性を示す含酸素収素環誘導体([[)のプロドラッグとし て用いることができる。すなわち、化合物(VII)または(VIII)を経口投 与すると、腸管等から吸収された後、生体内の酵素などの働きによりすみ やかに活性本体である含酸素複素環誘導体(II)が遊離されてくる。

15

20

25

かかる本発明化合物を臨床に応用するに際し、治療上有効な成分の担体 成分に対する割合は、1重量%から90重量%の間で変動されうる。例え ば、本発明の化合物は顆粒剤、細粒剤、散剤、硬カプセル剤、軟カプセル 剤、シロップ剤、乳剤、懸濁剤または液剤等の剤形にして経口投与しても よいし、注射剤として静脈内投与、筋肉内投与または皮下投与してもよい。 また、座剤として用いることもできる。また、注射用の粉末にして用事調 製して使用してもよい。経口、経腸、非経口に適した医薬用の有機または 無機の、固体または液体の担体もしくは希釈剤を本発明薬剤を調製するた めに用いることができる。固体製剤を製造する際に用いられる賦形剤とし ては、例えば乳糖、蔗糖、デンプン、タルク、セルロース、デキストリン、 カオリン、炭酸カルシウム等が用いられる。経口投与のための液体製剤、

10

15

すなわち乳剤、シロップ剤、懸濁剤、液剤等は、一般的に用いられる不活性な希釈剤、例えば水または植物油等を含む。この製剤は、不活性な希釈剤以外に補助剤、例えば湿潤剤、懸濁補助剤、甘味剤、芳香剤、着色剤または保存剤等を含むことができる。液体製剤にしてゼラチンのような吸収されうる物質のカプセル中に含ませてもよい。非経口投与の製剤、すなわち注射剤、座剤等の製造に用いられる溶剤または懸濁剤としては、例えば水、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、ベンジルアルコール、オレイン酸エチル、レシチン等が挙げられる。座剤に用いられる基剤としては、例えばカカオ脂、乳化カカオ脂、ラウリン脂、ウィテップゾール等が挙げられる。製剤の調製方法は常法によればよい。

臨床投与量は、経口投与により用いられる場合には、成人に対し本発明の化合物として、一般には一日量0.01~1000mgであるが、年令、病態、症状により適宜増減することがさらに好ましい。前記一日量の本発明薬剤は、一日に一回、または適当な間隔をおいて一日に2もしくは3回に分けて投与してもよいし、間欠投与してもよい。

また、注射剤として用いる場合には、成人に対し本発明の化合物として、 一日量0.001~100mgを連続投与又は間欠投与することが望ましい。

図面の簡単な説明

20 第1図は、実施例88の化合物をラットの血清に5分間インキュベート した後のHPLCチャートであり、第2図は、血清がない場合の、実施例 1の化合物と実施例88の化合物を混合して溶解したサンブルのHPLC チャートである。

発明を実施するための最良の形態

25 以下、参考例および実施例により本発明をさらに詳しく説明するが、本 発明はその要旨を越えない限り、これらの参考例および実施例に何ら制限 を受けるものではない。

参考例 1 (S) -3-((S)-4-x+n-2-7x+n-2-1) アミノバレリルアミノ) -2-x+3+1 アミノバレリルアミノ) -2-x+3+1 アミノバレリルアミノ)

塩化チオニル6m1を-5℃に冷却し、この反応液にN-フェニルスル ホニルーLーロイシン998mgを加えー5℃で10分間撹拌した後、室 5 温に戻しさらに3時間撹拌した。つぎに反応液を減圧下濃縮し、得られた 残渣にトルエン10mlを加え濃縮し残渣として粗なN-フェニルスルホ ニルーL-ロイシル=クロリドを得た。得られた粗なN-フェニルスルホ ニルーレーロイシルークロリドを塩化メチレン20m1に溶かし、氷冷下 Lーホモセリンラクトン塩酸塩443mgおよびトリエチルアミン0.9 10 46m1を加えた。反応液を氷冷下15分間撹拌した後さらに室温で1. 5時間撹拌した。反応終了後反応液に希塩酸を加え、塩化メチレンで抽出 した。抽出液を水、飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄した後、硫酸マグ ネシウムで乾燥してからこれを濾過した。濾液を濃縮し、得られた残渣に 15 酢酸エチル10m1およびヘキサン20m1を加え撹拌し生成した結晶を **濾取し目的物861mgを得た。**

収率: 76%

融点:183-184℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3331, 3256, 1772, 1649.

NMR (CDC1₃, δ): 0.67 (d, J=6.0Hz, 3H),

0.84 (d, J=6.3Hz, 3H), 1.45-1.56 (m, 3H),

1, 2.01 (m, 1H), 2.63 (m, 1H), 4.26 (m, 1H),

1, 4.36 (m, 1H), 4.45 (ddd, J=9.3Hz, 9.3Hz, 1.8Hz, 1H), 5.28 (d, J=8.1Hz, 1H), 6

25 .67 (d, J=6.0Hz, 1H), 7.52 (m, 2H), 7.60 (m, 1H), 7.88 (dd, J=7.2Hz, 1.5Hz, 2H).

実施例1 (3S)-3-((S)-4-メチル-2-フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号196)の製造

参考例1で得られた(S)-3-((S)-2-フェニルスルホニルア

ミノー4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノン413m
gを塩化メチレン60m1に溶解し、-78℃に冷却した。つぎに反応液
に1.01mo1/1の水素化ジイソブチルアルミニウムのトルエン溶液
3.81m1を加えた。3時間後反応液に飽和塩化アンモニウム水溶液および酢酸エチルを加え、室温に戻した後セライトで濾過し、セライトを酢
酸エチルでよく洗浄した。濾液を飽和食塩水で洗浄後硫酸マグネシウムで乾燥してからこれを濾過した。濾液を濃縮し、得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(展開溶媒30%ヘキサン含有酢酸エチル)で精製し、目的物191mgを得た。

収率: 46%

- 15 融点:162℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3337, 3260, 1649

NMR (CDC1, +DMSO-d6, δ): 0.72 (d, J=6.6 Hz, 2.7 H), 0.78 (d, J=6.3 Hz, 0.3 H), 0.84 (d, J=6.6 Hz, 2.7 H), 0.86 (d, J=6.3 Hz)

1. 1. 46 (t, J=7.2 Hz, 2 H), 1.63 (m, 2 H), 2.09 (m, 0.9 H), 2.25 (m, 0.1 H), 3.6 (d, J=3.81 (m, 2 H), 3.99-4.12 (m, 2 H), 4.95 (dr s, 0.1 H), 5.03 (d, J=3.6 Hz, 0.1 H), 5.15 (dd, J=3.9 Hz, 3.9 Hz, 0.9 H), 5.63 (d, J=3.9 Hz, 0.9 H), 6.89 (d, J=9.3 Hz, 0.1 H), 6.81 (d, J=8.1 Hz, 0.9 H), 6.89 (d, J=9.3 Hz, 0.1 H), 6.81 (d, J=8.1 Hz, 0.9 H), 6.89 (d, J=9.3 Hz, 0.9 H

20

7. 8 H z, 0. 9 H), 7. 1 4 (d, J=7. 2 H z, 0. 1 H), 7. 4 6 - 7. 5 8 (m, 3 H), 7. 8 5 (m, 2 H). この溶媒での異性体比は約 9: 1 である。

NMR (CD₃ OD, δ): 0. 74 (d, J=6. 5Hz, 3H),

- 0. 80 (d, J=6. 5Hz, 3H), 0. 86 (d, J=7. 1Hz, 3H), 0. 88 (d, J=6. 8Hz, 3H), 1. 34-1. 50 (m, 3H), 1. 64 (m, 1H), 2. 01 (m, 0. 4H), 2. 17 (m, 0. 6H), 3. 73-3. 97 (m, 4H), 4. 96 (s, 0. 6H), 5. 11 (d, J=4Hz, 0. 4H), 7. 53-7.
- 10 61 (m, 3H), 7.85 (m, 2H). この溶媒での異性体比は約6:4である。

参考例1および実施例1と同様の方法により、以下実施例2から実施例87の化合物を製造した。以下、その物性値を記す。

実施例 2 (3S) - 3 - ベンジロキシカルボニルアミノアセチルアミノ
- 2 - テトラヒドロフラノール(表 - 1 の化合物番号 1 7) の製造
融点: 1 1 9 - 1 2 1 ℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3314, 1692, 1649, 1541. NMR (CDC1₁, δ): 1.84 (m, 1H), 2.22-2.5 0 (m, 1H), 2.86 (s, 0.3H), 2.97 (s, 0.7H)

, 3. 79-4. 00 (m, 3H), 4. 11 (m, 1H), 4. 37 (
m, 1H), 5. 14 (s, 2H), 5. 27 (m, 1. 3H), 5. 3
9 (s, 0. 7H), 6. 12 (s, 0. 3H), 6. 42 (s, 0. 7
H), 7. 36 (m, 5H).

実施例3 (3S) - 3 - ((S) - 2 - ベンジロキシカルボニルアミノ
 25 プロピオニルアミノ) - 2 - テトラヒドロフラノール(表 - 1 の化合物番号18)の製造

融点:161-163℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3312, 1688, 1647, 1561, 1530.

NMR (CDC1₃, δ): 1. 36 (d, J=7. 2Hz, 0. 75 H), 1. 39 (d, 7. 2Hz, 2. 25H), 1. 81 (m, 1H), 2. 34 (m, 0. 75H), 2. 43 (m, 0. 25H), 2. 99 (s, 0. 25H), 3. 09 (s, 0. 75H), 3. 87 (ddd, J=7. 8Hz, 7. 8Hz, 7. 8Hz, 0. 75H), 4. 00 (m, 0. 25H), 4. 11 (m, 1H), 4. 22 (m, 1H), 4. 3 7 (m, 1H), 5. 11 (s, 2H), 5. 29 (m, 2H), 6. 2 8 (s, 0. 25H), 6. 45 (s, 0. 75H), 7. 35 (m, 5H).

実施例4 (3S)-3-((S)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ バレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号2

15 0)の製造

融点:148-149℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3299, 1694, 1645, 1539.

NMR (CDC1:, δ): 0.92 (m, 3H), 1.38 (m, 2H), 1.62 (m, 1H), 1.78 (m, 2H), 2.31 (m, 0.7H), 2.42 (m, 0.3H), 3.27 (s, 0.3H), 3.42 (s, 0.7H), 3.86 (ddd, J=7.8Hz, 7.8Hz, 7.8Hz

実施例 5 3 - ((S) - 2 - ベンジロキシカルボニルアミノ - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 - 3 -

融点:122-123℃

5 IR (KBr, cm⁻¹): 3302, 1694, 1647, 1537.

NMR (CDC1₃, δ): 0.94 (m, 6H), 1.83 (m, 1H), 2.12 (m, 1H), 2.30 (m, 0.6H), 2.44 (m, 0.4H), 3.40 (s, 0.4H), 3.49 (s, 0.6H), 3.82-4.06 (m, 2H), 4.10 (m, 1H), 4.38 (m, 1H), 5.09 (m, 2H), 5.26 (s, 0.4H), 5.32 (s, 0.6H), 5.50 (m, 1H), 6.32 (s, 0.2H), 6.45 (s, 0.4H), 6.54 (s, 0.2H), 6.68 (s, 0.2H), 7.34 (m, 5H).

実施例6 (3S)-3-((S)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ15 ヘキサノイルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号22)の製造

融点:165-166℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3304, 1694, 1645, 1539.

NMR (CDCl₃, δ): 0.87 (m, 3H), 1.32 (m, 3

20 H), 1.64 (m, 2H), 1.78 (m, 2H), 2.29 (m, 0.8H), 2.42 (m, 0.2H), 3.22 (s, 0.2H), 3.

39 (s, 0.8H), 3.86 (ddd, J=7.8Hz, 7.8Hz, 7.8

実施例 7 (3S) -3-((2S)-2-ベンジロキシカルボニルアミノ-3-メチルバレリルアミノ) -2-テトラヒドロフラノール (表 <math>-1 の化合物番号 23) の製造

融点:169-171℃

- 5 IR (KBr, cm⁻¹): 3299, 1694, 1649, 1539.

 NMR (CDC1₃, δ): 0.91 (m, 6H), 1.12 (m, 1H), 1.50 (m, 1H), 1.84 (m, 2H), 2.31 (m, 0.7H), 2.44 (m, 0.3H), 3.40 (s, 1H), 3.82

 -4.16 (m, 3H), 4.35 (m, 1H), 5.10 (s, 2H)

 10 , 5.26 (m, 1H), 5.41 (s, 1H), 6.17 (s, 0.3H), 6.40 (s, 0.7H), 7.38 (m, 5H).
- NMR (CD, OD, δ): 1. 00 (d, J=5.6Hz, 6H), 1. 69-1.83 (m, 3H), 1.98 (m, 1H), 2.24 (m, 0.5H), 2.34 (m, 0.5H), 3.84-4.07 (m, 4H), 4.95 (s, 0.5H), 4.99 (d, J=4.0Hz, 0.5H).
- 20 実施例 9 3-((S)-2-メトキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号25)の製造

融点:139-141℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3287, 3081, 1686, 1653,

25 1553.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 94 (m, 6H), 1. 50-1. 7

4 (m, 3H), 1. 81 (m, 1H), 2. 36 (m, 0. 6H), 2 . 48 (m, 0. 4H), 3. 44 (s, 0. 4H), 3. 58 (s, 0 . 6H), 3. 68 (s, 3H), 3. 99 (m, 0. 6H), 4. 01 (m, 0. 4H), 4. 13 (m, 2H), 4. 34 (m, 1H), 5.

5 27 (d, J=3.0Hz, 0.6H), 5.34 (m, 1.4H), 6 .49 (s, 0.4H), 6.57 (d, J=7.8Hz, 0.4H), 6.68 (s, 0.2H).

実施例10 (3S) -3-((S) -2-tert-プトキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ) -2-テトラヒドロフラノール(

10 表-1の化合物番号27)の製造

融点:65-70℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3310, 1698, 1657.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 95 (m, 6H), 1. 44 (s, 4 . 5H), 1. 44 (s, 4 . 5H), 1. 48 (m, 1H), 1. 66

15 (m, 2H), 1. 81 (m, 1H), 2. 33 (m, 0. 5H), 2. 46 (m, 0. 5H), 3. 88 (ddd, J=7. 5Hz, 7. 5Hz, 7. 5Hz, 0. 5H), 4. 01 (ddd, J=8. 4Hz, 8. 4 Hz, 8. 4Hz, 0. 5H), 4. 12 (m, 2H), 4. 36 (m,

1 H), 4. 9 6 (d, J=7. 8 Hz, 0. 5 H), 5. 0 3 (m, 0 20 . 5 H), 5. 2 6 (s, 0. 5 H), 5. 3 3 (s, 0. 5 H), 6. 4 7 (m, 0. 5 H), 6. 6 1 (m, 0. 5 H).

実施例11 (3S) -3-((S) -2-4ソプトキシカルボニルアミノー4-4チルバレリルアミノ) -2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号28)の製造

25 融点: 31-33℃ IR (KBr, cm⁻¹): 3310, 1699, 1657, 1543. NMR (CDC1₃, δ): 0. 94 (m, 12H), 1. 47-2. 00 (m, 5H), 2. 36 (m, 0. 5H), 2. 45 (m, 0. 5H), 2. 96 (s, 0. 5H), 3. 17 (s, 0. 5H), 3. 90 (m, 1. 5H), 4. 02 (m, 0. 5H), 4. 15 (m, 2H), 4. 36 (m, 1H), 5. 08 (m, 1H), 5. 27 (s, 0. 5H), 5. 35 (s, 0. 5H), 6. 24 (s, 0. 5H), 6. 50 (s, 0. 5H).

実施例12 (3S) - 3 - ((S) - 2 - シクロヘキシルメトキシカルボニルアミノー4 - メチルバレリルアミノ) - 2 - テトラヒドロフラノー

IR (KBr, cm⁻¹): 3310, 1703, 1659, 1545.

10 ル (表-1の化合物番号29)の製造

融点:52-54℃

NMR (CDC1₃, δ): 0. 93 (m, 8H), 1. 26-1. 3 3 (m, 4H), 1. 43-1. 92 (m, 9H), 2. 36 (m, 0. 5H), 2. 50 (m, 0. 5H), 3. 22 (s, 0. 5H), 3. 4 9 (s, 0. 5H), 3. 87-4. 23 (m, 5H), 4. 34 (m, 1H), 5. 13 (m, 1H), 5. 26 (d, J=2. 7Hz, 0. 5 H), 5. 32 (dd, J=3. 9Hz, 3. 9Hz, 0. 5H), 5. 34 (s, 0. 5H), 6. 53 (s, 0. 5H).

20 実施例13 (3S)-3-((S)-2-ベンジロキシカルボニルアミノー4-メチルバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号31)の製造

- 融点:40-43℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3306, 1705, 1657.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 92 (d, J=6.1Hz, 3H), 0. 94 (d, J=5.9Hz, 3H), 1. 52 (m, 1H), 1. 6

- 4 (m, 2H), 1. 78 (m, 1H), 2. 29 (m, 0. 5H), 2
- . 41 (m, 0. 5H), 3. 51 (s, 0. 5H), 3. 74 (s, 0
- .5H), 3. 85 (ddd, J=8. 0Hz, 8. 0Hz, 8. 0Hz
- , 0. 5 H), 3. 9 7 (m, 0. 5 H), 4. 10 (m, 2 H), 4.
- 5 32 (m, 1H), 5. 09 (s, 1H), 5. 10 (s, 1H), 5.
 - 24 (s, 0. 5H), 5. 29 (s, 0. 5H), 5. 35 (d, J=
 - 6.5 Hz, 0.5 H), 5.38 (d, J=8.2 Hz, 0.5 H),
 - 6. 45 (d, J=6. 0 Hz, 0. 5 H), 6. 57 (d, J=6. 0
 - Hz, 0. 5H), 7. 33 (m, 5H).
- 10 実施例14 (3S)-3-{(S)-2-(N-ベンジロキシカルボニル-N-メチル)アミノー4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号32)の製造

IR (neat): 3335, 1669.

- NMR (CDC1₃, δ): 0. 93 (m, 6H), 1. 49 (m, 1
- 15 H), 1. 69 (m, 3H), 2. 28 (m, 0. 5H), 2. 39 (m
 - , 0. 5H), 2. 85 (s, 1. 5H), 2. 86 (s, 1. 5H),
 - 3. 12 (s, 0. 5H), 3. 30 (s, 0. 5H), 3. 85 (m.
 - 1H), 4. 07 (m, 1H), 4. 29 (m, 1H), 4. 60 (m.
 - 0. 5H), 4. 70 (m, 0. 5H), 5. 09-5. 26 (m, 3H)
- 20), 6. 24 (s, 0. 5H), 6. 53 (s, 0. 5H), 7. 36 (m, 5H).
 - 実施例 15 (3S) -3- {(S) -2-(4-フルオロベンジロキシカルボニルアミノ) -4-メチルバレリルアミノ} -2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号 37)の製造
- 25 融点:50-52℃
 - IR (KBr, cm⁻¹): 3310, 1705, 1657, 1607,

1541, 1514.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 93 (m, 6H), 1. 47-1. 9 0 (m, 4H), 2. 32 (m, 0. 5H), 2. 44 (m, 0. 5H) , 3. 10 (s, 0. 5H), 3. 35 (s, 0. 5H), 3. 87 (d dd, J=7. 8Hz, 7. 8Hz, 7. 8Hz, 0. 5H), 3. 98 (m, 0. 5H), 4. 11 (m, 2H), 4. 33 (m, 1H), 5. 04 (s, 1H), 5. 06 (s, 1H), 5. 25 (m, 2H), 6. 20 (bs, 0. 5H), 6. 46 (d, J=8. 1Hz, 0. 5H), 7. 03 (dd, J=8. 7Hz, 2H), 7. 33 (m, 2H).

実施例16 (3S) -3-{(S) -2-(2-クロロベンジロキシカルボニルアミノ) -4-メチルバレリルアミノ} -2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号38)の製造

融点:46-49℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3308, 1707, 1657, 1541.

NMR (CDC1, δ): 0.94 (m, 6H), 1.48-1.8
6 (m, 4H), 2.32 (m, 0.6H), 2.48 (m, 0.4H)
, 2.90 (s, 0.4H), 3.09 (s, 0.6H), 3.88 (d
dd, J=7.8Hz, 7.8Hz, 7.8Hz, 0.6H), 4.01
(m, 0.4H), 4.11 (m, 2H), 4.34 (m, 1H), 5.

20 23 (s, 2H), 5.25 (m, 2H), 6.18 (s, 0.4H),
6.45 (d, J=7.6Hz, 0.6H), 7.26 (m, 2H), 7

実施例17 (3S) -3- {(S) -2-(4-2ロロベンジロキシカルボニルアミノ) -4-メチルバレリルアミノ} -2-テトラヒドロフラノール (表-1 の化合物番号40) の製造

融点:47-49℃

25

40 (m, 2H).

IR (KBr, cm⁻¹): 3308, 1705, 1657, 1541.

NMR (CDC1₃, δ): 0.94 (m, 6H), 1.50-1.8
6 (m, 4H), 2.32 (m, 0.7H), 2.44 (m, 0.3H)

, 2.88 (s, 0.3H), 3.03 (s, 0.7H), 3.88 (d

dd, J=7.8Hz, 7.8Hz, 7.8Hz, 0.7H), 3.95

(m, 0.3H), 4.12 (m, 2H), 4.35 (m, 1H), 5.

06 (s, 0.6H), 5.07 (s, 1.4H), 5.22 (m, 1.3H), 5.30 (s, 0.7H), 6.09 (s, 0.3H), 6.3

9 (d, J=8.7Hz, 0.7H), 7.31 (m, 4H).

10 実施例18 (3S)-3-{(S)-4-メチル-2-(2-メチルベンジロキシカルボニルアミノ) バレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号44)の製造

融点:120~122℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3302, 1694, 1645, 1541.

- NMR (CDC1₃, δ): 0. 93 (m, 6H), 1. 52 (m, 1H), 1. 59 (m, 3H), 2. 16-2. 49 (m, 1H), 2. 34 (s, 3H), 3. 28 (s, 0. 5H), 3. 52 (s, 0. 5H), 3. 86 (dd, J=7. 8Hz, 7. 8Hz, 7. 8Hz, 0. 5H), 3. 98 (m, 0. 5H), 4. 13 (m, 2H), 4. 31 (m,
- 20 1 H), 5. 1 2 (s, 2 H), 5. 2 7 (m, 2 H), 6. 3 4 (s, 0. 5 H), 6. 5 1 (s, 0. 5 H), 7. 1 9 (m, 2 H), 7. 3 1 (m, 2 H).

実施例19 (3S)-3-{(S)-4-メチル-2-(4-メチルベンジロキシカルボニルアミノ) バレリルアミノ) -2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号46)の製造

IR (KBr, cm⁻¹): 3310, 1703, 1657, 1539.

NMR (CDC13, 8): 0. 93 (m, 6H), 1. 52 (m, 1H), 1. 58-1. 86 (m, 3H), 2. 29 (m, 0. 5H), 2. 35 (s, 3H), 2. 43 (m, 0. 5H), 2. 91 (s, 0. 5H), 3. 03 (s, 0. 5H), 3. 87 (ddd, J=7. 8Hz, 7. 8Hz, 7. 8Hz, 0. 5H), 3. 97 (m, 0. 5H), 4. 10 (m, 2H), 4. 33 (m, 1H), 5. 06 (s, 2H), 5. 14 (m, 1H), 5. 26 (m, 1H), 6. 20 (s, 0. 5H), 6. 44 (s, 0. 5H), 7. 16 (m, 2H), 7. 23 (m, 2H)).

10 実施例20 (3S)-3-{(S)-2-(2-メトキシベンジロキシカルボニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号47)の製造

融点:36-38℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3308, 1703, 1657, 1539.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 93 (m, 6H), 1. 51 (m, 1H), 1. 60-1. 91 (m, 3H), 2. 30 (m, 0. 6H), 2

. 42 (m, 0. 4H), 3. 15 (s, 0. 4H), 3. 31 (d, J

= 3. 0 Hz, 0. 6 H), 3. 8 3 (s, 3 H), 3. 8 7 (m, 0. 6 H), 3. 9 1 (m, 0. 4 H), 4. 1 3 (m, 2 H), 4. 3 2 (

20 m, 1H), 5. 16 (s, 0. 8H), 5. 18 (s, 1. 2H), 5

. 23 (m, 2H), 6.65 (s, 0.4H), 6.53 (d, J=7

. 5 Hz, 0. 6 H), 6. 9 1 (m, 2 H), 7. 3 1 (m, 2 H).

実施例 21 $(3S) - 3 - {(S) - 2 - (4 - メトキシベンジロキシ$

カルボニルアミノ) -4-メチルバレリルアミノ} -2-テトラヒドロフ

25 ラノール (表1の化合物番号49) の製造

融点:30-33℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3310, 1701, 1657, 1516.

NMR (CDC1₃, δ): 0.92 (m, 6H), 1.50 (m, 1H), 1.59-1.88 (m, 3H), 2.29 (m, 0.5H), 2.42 (m, 0.5H), 3.01 (s, 0.5H), 3.20 (d, J=3.0Hz, 0.5H), 3.80 (s, 3H), 3.88 (ddd, J=7.8Hz, 7.8Hz, 7.8Hz, 0.5H), 3.96 (m, 0.5H), 4.11 (m, 2H), 4.33 (m, 1H), 5.03 (s, 2H), 5.15 (m, 1H), 5.27 (s, 0.5H), 5.32 (s, 0.5H), 6.22 (s, 0.5H), 6.66 (s, 0.5H), 6.87 (m, 2H), 7.28 (m, 2H).

融点:150-153℃

15 IR (KBr, cm⁻¹): 3314, 1725, 1696, 1653, 1534.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 93 (m, 6H), 1. 65 (m, 3H), 1. 91 (m, 1H), 2. 32 (m, 0. 7H), 2. 42 (m, 0. 3H), 3. 08 (s, 0. 3H), 3. 28 (d, J=3Hz,

- 20 0. 7 H), 3. 8 6 (ddd, J=7. 8 Hz, 7. 8 Hz, 7. 8 Hz, 7. 8 Hz, 0. 7 H), 4. 01 (m, 0. 3 H), 4. 08-4. 24 (m, 3 H), 4. 32-4. 52 (m, 3 H), 5. 27 (m, 2 H), 6. 21 (s, 0. 3 H), 6. 38 (s, 0. 7 H), 7. 31 (m, 2 H), 7. 40 (m, 2 H), 7. 56 (dd, J=7. 4 Hz, 2 H),
- 25 7.76 (d, J=7.4 Hz, 2 H).実施例23 (3S)-3-((S)-4-メチル-2-テトラヒドロフ

ルフリルオキシカルボニルアミノバレリルアミノ) -2-テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号52)の製造

融点:40-43℃

. 56 (s, 0. 5H).

IR (KBr, cm⁻¹): 3308, 1705, 1659, 1543.

5 NMR (CDC1₃, δ): 0.94 (m, 6H), 1.46-2.0
7 (m, 8H), 2.32 (m, 0.5H), 2.46 (m, 0.5H)
, 3.36 (s, 0.5H), 3.39 (s, 0.5H), 3.78-4
.25 (m, 8H), 4.29-4.42 (m, 1H), 5.28 (m,
1.5H), 5.40 (s, 0.5H), 6.34 (s, 0.5H), 5

実施例24 (3S)-3-{(S)-4-メチル-2-(2-テトラヒドロピラニルメトキシカルボニルアミノ) バレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号53)の製造

IR (KBr, cm⁻¹): 3306, 1705, 1659, 1539.

- 15 NMR (CDC1, δ): 0. 94 (m, 6H), 1. 30 (m, 1H), 1. 53 (m, 3H), 1. 68 (m, 4H), 1. 84 (m, 2H), 2. 32 (m, 0. 5H), 2. 47 (m, 0. 5H), 3. 44 (m, 1H), 3. 55 (m, 1H), 3. 65 (s, 0. 5H), 3. 74 (s, 0. 5H), 3. 98 (ddd, J=7. 8Hz, 7. 8Hz), 7. 8Hz, 7.
- 実施例25 (3S)-3-{(S)-4-メチル-2-(2-ピリジル 25 メトキシカルボニルアミノ) バレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノ -ル(表-1の化合物番号54)の製造

融点:54-56℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3306, 1711, 1657, 1541.

NMR (CDC1, δ): 0.95 (m, 6H), 1.53 (m, 2H), 1.68 (m, 3H), 2.28 (m, 0.5H), 2.47 (m, 0.5H), 3.85 (ddd, J=8.1Hz, 8.1Hz, 8.1Hz, 8.1Hz, 8.1Hz, 0.5H), 3.97 (ddd, J=8.1Hz, 8.1Hz, 8.1Hz, 8.1Hz, 0.5H), 4.08-4.44 (m, 3H), 5.10-5.36 (m, 3H), 5.75 (s, 1H), 6.67 (s, 0.5H), 6.69 (s, 0.5H), 7.19-7.40 (m, 2H), 7.610 (d, J=3.9Hz, 0.5H).

実施例 26 $3-{(S)-4-x+n-2-(2-ピリジルxトキシカルボニルアミノ) バレリルアミノ} -2-テトラヒドロフラノール N-オキシド (表-1の化合物番号 57) の製造$

- 15 NMR (CDC1₃, δ): 0. 93 (m, 6H), 1. 50-1. 9
 2 (m, 4H), 2. 10-2. 48 (m, 1H), 2. 86 (s, 0.
 8 H), 3. 30 (s, 0. 2H), 3. 84 (m, 1H), 4. 08 (
 m, 1H), 4. 36 (m, 2H), 5. 10-5. 68 (m, 3H),
 5. 99 (s, 0. 5H), 6. 12 (s, 0. 3H), 6. 30 (m,
- 20 0. 2H), 6. 82-7. 07 (m, 1H), 7. 35 (m, 3H), 8. 28 (d, J=8. 6Hz, 1H).

実施例 27 (3S) - 3 - ((S) - 2 - シクロヘキシルオキシカルボニルアミノー <math>4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 - 4 -

25 融点: 28-30℃ IR (KBr, cm⁻¹): 3310, 1696, 1657, 1539. NMR (CDC1₃, δ): 0. 95 (m, 6H), 1. 29 (m, 2H), 1. 36 (m, 4H), 1. 53 (m, 2H), 1. 69 (m, 4H), 1. 85 (m, 2H), 2. 36 (m, 0. 5H), 2. 48 (m, 0. 5H), 2. 85 (s, 0. 5H), 3. 06 (s, 0. 5H), 3. 89 (ddd, J=7. 8Hz, 7. 8Hz, 7. 8Hz, 0. 5H), 4. 02 (m, 0. 5H), 4. 14 (m, 2H), 4. 36 (m, 1H), 4. 63 (m, 1H), 4. 99 (m, 1H), 5. 26 (m, 0. 5H), 5. 32 (m, 0. 5H), 6. 22 (s, 0. 5H), 6. 47 (s, 0. 5H).

10 実施例28 (3S)-3-((S)-4-メチル-2-フェノキシカル ボニルアミノバレリルアミノ)-2-テトラヒドロフラノール(表-1の 化合物番号61)の製造

融点:68-70℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3308, 1723, 1659, 1539.

- NMR (CDC1₃, δ): 0. 98 (m, 6H), 1. 52 (m, 1H), 1. 58-1. 86 (m, 3H), 2. 30-2. 52 (m, 1H), 2. 98 (s, 0. 6H), 3. 23 (s, 0. 4H), 3. 89 (ddd, J=7. 8Hz, 7. 8Hz, 7. 8Hz, 0. 6H), 4. 0 (ddd, J=7. 8Hz, 7. 8Hz, 7. 8Hz, 0. 4H), 4. 0. 09-4. 27 (m, 2H), 4. 38 (m, 1H), 5. 27 (d, J=2. 7Hz, 0. 4H). 5. 33 (dd, J=3. 6Hz, 3. 6Hz, 0. 6H), 5. 60 (s, 1H), 6. 10 (s, 0. 4H), 6. 24 (s, 0. 6H), 7. 12 (m, 2H), 7. 20 (m, 1H), 7. 35 (m, 2H).
- 25 実施例 2 9 (3 S) -3-((S)-4-x チルー 2-7 ェニルウレイ ドバレリルアミノ) -2- テトラヒドロフラノール (表 -1 の化合物番号

63)の製造

融点:181-182℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3291, 1638, 1555.

NMR (CDC1₂, δ): 0. 96 (m, 6H), 1. 50 (m, 2

5 H), 1. 67 (m, 1H), 1. 86 (m, 1H), 2. 26 (m, 0

. 5H), 2. 41 (m, 0. 5H), 2. 88 (s, 0. 5H), 3.

40 (s, 0, 5H), 3.82 (ddd, J=7.8Hz, 7.8Hz)

, 7. 8 Hz, 0. 5 H), 4. 0 7 (m, 1. 5 H), 4. 2 9 (m,

2H), 5. 20 (s, 0. 5H), 5. 26 (d, J=4. 5Hz, 0

10 . 5 H), 5. 9 8 (m, 1 H), 7. 0 2 (m, 1 H), 7. 2 4 (m

, 5H), 7. 73 (s, 0. 5H), 7. 91 (s, 0. 5H).

実施例 30 (3S) -3- ((S) -2-(3, 3-ジメチルブチリル

 $T \in \mathcal{I}$ $-4 - \mathcal{I} \in \mathcal{I}$ $-2 - \mathcal{I} \in \mathcal{I}$

表-1の化合物番号73)の製造

15 融点:152-153℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3293, 1642, 1549.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 93 (m, 6H), 1. 02 (s, 9

H), 1, 49-1, 94 (m, 4H), 2, 07 (s, 1H), 2, 0

8 (s, 1 H), 2. 32 (m, 0. 5 H), 2. 45 (m, 0. 5 H)

20 , 3, 17 (d, J=3, 0Hz, 0, 5H), 3, 73 (d, J=3.

0 H z, 0.5 H), 3.87 (ddd, J=7.8 H z, 7.8 H z,

7. 8 Hz, 0. 5 H), 4. 0 2 (m, 0. 5 H), 4. 1 0 (m, 1

H), 4.23-4.54 (m, 3H), 5.28 (d, J=2.4Hz

0.5H, 5.31 (dd, J=2.4Hz, 2.4Hz, 0.5H

25), 6. 62 (s, 0. 5H), 6. 69 (s, 0. 5H).

実施例31 (3S) - 3-((S) - 4-メチル-2-テトラデカノイ

ルアミノバレリルアミノ) -2-テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号78)の製造

融点:96-98℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3292, 1636, 1543.

5 NMR (CDC1₃, δ): 0.88 (t, J=5.3Hz, 3H),
0.94 (m, 6H), 1.25 (m, 22H), 1.51-1.94 (
m, 4H), 2.20 (m, 2H), 2.31 (m, 0.5H), 2.4
3 (m, 0.5H), 3.10 (d, J=2.7Hz, 0.5H), 3.
65 (d, J=2.7Hz, 0.5H), 3.87 (ddd, J=7.8)

10 Hz, 7. 8Hz, 7. 8Hz, 0. 5H), 4. 00 (ddd, J=7. 8Hz, 7. 8Hz, 0. 5H), 4. 11 (m, 1H), 4. 26-4. 55 (m, 2H), 5. 27 (d, J=2. 7Hz, 0. 5H), 5. 31 (dd, J=4. 1Hz, 4. 1Hz, 0. 5H), 5. 97 (s, 1H), 6. 52 (s, 0. 5H), 6. 62 (s, 0.

15 5 H).

実施例32 (3S)-3-{(S)-4-メチル-2-(3-フェニル プロピオニルアミノ) バレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号83)の製造

融点:60-62℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3291, 1644, 1549.

NMR (CDC1;, δ): 0.89 (m, 6H), 1.81 (m, 1H), 1.44-1.62 (m, 3H), 2.28-2.46 (m, 1H), 2.50 (m, 2H), 2.77 (s, 0.6H), 2.93 (m, 2H), 3.08 (s, 0.4H), 3.87 (ddd, J=7.8Hz, 7.8Hz, 7.8Hz, 0.6H), 4.05 (ddd, J=7.8Hz, 7.8Hz, 7.8Hz, 0.4H), 4.12 (m, 1H), 4

- . 24-4. 48 (m, 2H), 5. 24 (s, 0.4H), 5. 29 (m, 0.6H), 5. 79 (m, 1H), 6. 28 (d, J=7.5Hz, 0.4H), 6. 45 (d, J=7.5Hz, 0.6H), 7. 23 (m, 5H).
- 5 実施例33 (3S)-3-{(S)-4-メチル-2-(1-ナフチル アセチルアミノ) バレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号85)の製造

融点:164-167℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3279, 1638.

- NMR (CDC1₂ +DMSO-d6, δ) : 0. 76 (d, J=6. 10 0 H z, 3 H), 0.78 (d, J = 5.8H z, 3 H), 1.35 (m , 2H), 1. 48 (m, 1H), 1. 72 (m, 1H), 2. 19 (m , 0. 7 H), 2. 31 (m, 0. 3 H), 3. 78 (ddd, J=8. 0 Hz, 8. 0 Hz, 8. 0 Hz, 0. 7 H), 3. 85 (ddd, J =8. 0 Hz, 8. 0 Hz, 8. 0 Hz, 0. 3 H), 3. 97-4. 09 15 (m, 3H), 4, 20 (m, 1H), 4, 41 (m, 1H), 5, 09 (d, J=4.0Hz, 0.3H), 5.15(d, J=3.7Hz, 0)3H), 5. 22 (dd, J=4, 4Hz, 4. 4Hz, 0. 7H), 5. 38 (d, J=4. 3Hz, 0. 7H), 6. 42 (d, J=7. 8Hz, 0. 7 H), 6. 5 6 (d, J=9, 0 Hz, 0. 3 H), 6. 7 20 1 (d, J=7, 4Hz, 0, 7H), 6, 97 (d, J=7, 2Hz, 0.3H), 7.42-7.53 (m, 4H), 7.55-7.88 (m

融点:30℃

IR $(KBr, cm^{-1}): 3297, 1653.$

NMR (CDC1₈, δ): 0. 92 (d, J=6. 0Hz, 3H),

0. 92 (d, J = 5. 7 Hz, 3 H), 1. 55 - 1. 70 (m, 2 H)

5), 1. 84 (m, 2H), 2. 32 (m, 0. 6H), 2. 45 (m,

0.4H), 3.87 (ddd, J=7.8Hz, 7.8Hz, 7.8H

z, 0. 6H), 4. 01 (ddd, J=7. 8Hz, 7. 8Hz, 7.

8 Hz, 0. 4 H), 4. 11 (m, 1 H), 4. 33 (m, 1 H), 4

. 51 (s, 0.8H), 4.52 (s, 1.2H), 4.55 (m, 1

10 H), 5. 28 (s, 0. 4H), 5. 33 (d, J = 4. 5Hz, 0.

6H), 6.63 (d, J=7.5Hz, 0.4H), 6.68 (d, J

 $= 8.1 \,\mathrm{Hz}$, 0.6H), 6.93 (m, 2H), 7.03 (m, 2H)

), 7. 31 (m, 2H).

ル (表-1の化合物番号94)の製造

融点:49-52℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3302, 3074, 1655, 1537.

NMR (CDC1:, δ): 0. 94 (m, 6H), 1. 60-1. 9

20 1 (m, 4H), 2. 31 (m, 0. 7H), 2. 45 (m, 0. 3H)

, 3. 27 (d, J=2. 7 Hz. 0. 3 H), 3. 72 (d, J=2.

 $7 \, \text{Hz}$, 0. $7 \, \text{H}$), 3. $8 \, 7 \, (\text{ddd}$, J = 7. $8 \, \text{Hz}$, 7. $8 \, \text{Hz}$,

7. 8 Hz, 0. 7 H), 4. 06 (ddd, J = 7. 8 Hz, 7. 8 H

z, 7.8 Hz, 0.3 H), 4.11 (m, 1 H), 4.40 (m, 1

25 H), 4. 52 (m, 1H), 4. 52 (s, 0. 6H), 4. 57 (s

, 1. 4 H), 5. 2 9 (s, 0. 3 H), 5. 3 3 (dd, J = 3. 6

Hz, 3. 6Hz, 0. 7H), 6. 49 (s, 0. 3H), 6. 64 (s, 0. 7H), 6. 90 (m, 1H), 7. 02 (m, 1H), 7. 2 6 (m, 2H), 7. 41 (m, 1H).

実施例36 (3S)-3-{(S)-2-(4-クロロフェノキシアセチルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号96)の製造

融点:53-55℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3301, 1653, 1541.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 94 (m, 6H), 1. 69-1. 8 8 (m, 4H), 2. 32 (m, 0. 5H), 2. 58 (m, 0. 5H) 10 , 2. 91 (d, J=2. 8 Hz, 0. 5 H), 3. 28 (d, J=3. 0 Hz, 0.5 H), 3.88 (ddd, J=7.8 Hz, 7.8 Hz, 7. 8Hz, 0. 5H), 4. 06 (ddd, J=7. 8Hz, 7. 8Hz, 7.8 Hz, 0.5 H), 4.12 (m, 1 H), 4.34 (m, 1 15 H), 4. 47 (s, 1H), 4. 49 (s, 1H), 4. 53 (m, 1 H), 5. 28 (d, J=2. 6Hz, 0. 5H), 5. 33 (dd, J=4.5Hz, 4.5Hz, 0.5H), 6.29 (s, 0.5H), 6. 47 (s, 0. 5H), 6, 88 (m, 3H), 7, 27 (m, 2H). 実施例37 (3S)-3-((S)-4-メチル-2-フェニルチオア セチルアミノバレリルアミノ) -2-テトラヒドロフラノール(表-1の 20 化合物番号110)の製造

融点:45-47℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3287, 1645, 1551.

NMR (CDC1, δ): 0.81 (m, 6H), 1.35 (m, 1 25 H), 1.52 (m, 2H), 1.70 (m, 1H), 2.25 (m, 0 .5H), 2.39 (m, 0.5H), 3.23 (s, 0.5H), 3. 66 (m, 2.5H), 3.85 (ddd, J=7.8Hz, 7.8Hz, 7.8Hz, 7.8Hz, 7.8Hz, 0.5H), 3.96 (ddd, J=7.8Hz, 7.8Hz, 7.8Hz, 7.8Hz, 0.5H), 4.09 (m, 1H), 4.40-4.42 (m, 2H), 5.23 (d, J=2.3Hz, 0.5H), 5.28 (dd, J=3.9Hz, 3.9Hz, 0.5H), 6.39 (s, 0.5H), 6.53 (s, 0.5H), 7.10 (m, 1H), 7.21 (m, 1H), 7.29 (m, 3H), 7.30 (s, 1H).

IR (KBr, cm⁻¹): 3301, 1649, 1547.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 93 (m, 6H), 1. 48-1. 7 4 (m, 5H), 1. 80-1. 92 (m, 1H), 2. 30 (m, 0.

5H), 2. 43 (m, 0. 5H), 2. 72 (m, 2H), 3. 41 (

- 15 m, 1 H), 3. 5 2 (m, 1 H), 3. 8 6 (ddd, J=8. 1 Hz, 8. 1 Hz, 8. 1 Hz, 0. 5 H), 4. 0 2 (m, 0. 5 H), 4. 0 9 (m, 2 H), 4. 28-4. 48 (m, 2 H), 5. 29 (s,
 - 0.5H), 5.33 (dd, J=4.2Hz, 4.2Hz, 0.5H)
 - , 6. 27 (s, 1H), 6. 46 (s, 0. 5H), 6. 58 (s, 0
- 20 . 5 H), 7. 5 9 (m, 2 H), 7. 6 9 (m, 1 H), 7. 9 3 (d d, J=7. 2 Hz, 5. 4 Hz, 2 H).

実施例39 (3S) -3-((S) -2-ベンゾイルアミノー4-メチルバレリルアミノ) -2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号112)の製造

25 融点: 154-156℃ IR (KBr, cm⁻¹): 3300, 1665, 1636. NMR (CDC1₃, δ): 0. 98 (d, J=5. 5Hz, 6H),

- 1. 71 (m, 3H), 1. 87 (m, 1H), 2. 31 (m, 0. 7H)
-), 2. 42 (m, 0. 3H), 3. 16 (s, 0. 3H), 3. 60 (
- s, 0. 7H), 3. 87 (ddd, J=8. 2Hz, 8. 2Hz, 8.
- 5 2Hz, 0.7H), 4.03 (ddd, J=7.5Hz, 7.5Hz,
 - 7. 5 Hz, 0. 3 H), 4. 12 (ddd, J=8. 6 Hz, 8. 6 H
 - z, 3, 5 Hz, 1 H), 4, 3 6 (m, 1 H), 4, 6 8 (m, 1 H)
 - , 5. 30 (s, 0. 3H), 5. 35 (d, J=4. 7Hz, 0. 7H
 -), 6.67-6.75 (m, 2H), 7.43 (m, 2H), 7.52
- 10 (m, 1 H), 7. 7 9 (m, 2 H).

実施例 40 (3S) -3- {(S) -2- (2-フルオロベンゾイルアミノ) -4- メチルバレリルアミノ} -2- テトラヒドロフラノール (表 -1 の化合物番号 1 13) の製造

融点:62-64℃

- 15 IR (KBr, cm⁻¹): 3306, 1644, 1534.
 - - 9-2.01 (m, 4H), 2.40 (m, 1H), 3.82 (m, 1H

NMR (CDC1₂, δ): 0, 80-1, 07 (m, 6H), 1, 5

-), 3, 97-4, 20 (m, 1, 6H), 4, 24-4, 45 (m, 1
- .4H), 4.68 (m, 1H), 5.31 (d, J=2.5Hz, 0.
- 20 6 H), 5. 35 (dd, J=4. 2 Hz, 4. 1 Hz, 0. 4 H), 6
 - . 87 (m, 1H), 7. 02-7. 20 (m, 2H), 7. 25 (m,
 - 1H), 7. 50 (m, 1H), 8. 00 (m, 1H).
- ミノ)-4-メチルパレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール(表
- 25 1の化合物番号 1 1 4)の製造

融点:159-161℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3304, 3076, 1638, 1588, 1547.

NMR (CDC1, , δ): 0.87-1.07 (m, 6H), 1.6

1-1.98 (m, 4H), 2.39 (m, 1H), 3.39 (d, J=

2.6Hz, 0.5H), 3.87 (m, 1H), 3.98-4.18 (
m, 1.5H), 4.35 (m, 1H), 4.67 (m, 1H), 5.3

1 (d, J=2.6Hz, 0.5H), 5.35 (dd, J=4.1Hz, 4.1Hz, 0.5H), 6.71 (d, J=7.6Hz, 0.5H), 6.76 (d, J=7.6Hz, 0.5H), 6.90 (d, J=8.

2 H z, 0, 5 H), 6, 9 9 (d, J = 8, 2 H z, 0, 5 H), 7, 2 0 (d d d, J = 8, 2 H z, 8, 2 H z, 2, 7 H z, 1 H), 7, 4 0 (m, 1 H), 7, 4 3 - 7, 6 0 (m, 2 H).

15 - 1の化合物番号115)の製造

融点:151-153℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3422, 3301, 1640, 1545, 1503.

NMR (CDC1, , δ): 0. 85-1. 17 (m, 6H), 1. 6 20 0-1. 97 (m, 4H), 2. 37 (m, 1H), 3. 79 (d, J= 2. 7Hz, 0. 55H), 3. 87 (m, 0. 55H), 4. 06 (m, 0. 45H), 4. 10 (m, 1H), 4. 27 (ddd, J=6. 8 Hz, 6. 8Hz, 2. 1Hz, 0. 45H), 4. 39 (m, 1H), 5. 31 (d, J=2. 7Hz, 0. 55H), 5. 35 (d, J=4. 25 1Hz, 4. 1Hz, 0. 45H), 6. 28 (d, J=8. 3Hz, 0 45H), 6. 96 (d, J=8. 3Hz, 0. 55H), 7. 02-

7. 19 (m, 3H), 7. 75-7. 89 (m, 2H).
 実施例43 (3S)-3-{(S)-2-(4-クロロベンゾイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号121)の製造

5 融点:93-96℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3295, 1636.

NMR (CDC1, δ): 0. 95 (d, J=6.0Hz, 3H),
0. 97 (d, J=5.7Hz, 3H), 1. 73 (m, 3H), 1. 8
6 (m, 1H), 2. 31 (m, 0.7H), 2. 42 (m, 0.3H),
3. 41 (s, 0.3H), 3. 86 (s, 0.7H), 3. 87 (d
dd, J=8. 4Hz, 8. 4Hz, 8. 4Hz, 0.7H), 4. 02
(ddd, J=7. 8Hz, 7. 8Hz, 7. 8Hz, 0.3H), 4.
12 (m, 1H), 4. 35 (m, 1H), 4. 68 (m, 1H), 5.
30 (s, 0.3H), 5. 35 (d, J=4.5Hz, 0.7H), 6
. 71 (d, J=8.1Hz, 0.7H), 6. 76 (d, J=6.9H
z, 0.3H), 6. 87 (d, J=6.4Hz, 0.7H), 6. 95
(d, J=8.1Hz, 0.3H), 7. 39 (dd, J=8.4Hz,
1. 8Hz, 2H), 7. 73 (dd, J=8.4Hz, 2.1Hz, 2H).

20 実施例 4 4 (3 S) - 3 - {(S) - 4 - メチル-2 - (2 - メチルベンゾイルアミノ) バレリルアミノ} - 2 - テトラヒドロフラノール (表 - 1 の化合物番号 1 2 5) の製造

融点:73-74℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3293, 1638, 1541.

25 NMR (CD₃ OD, δ): 0. 98 (d, J=6.1Hz, 6H), 1. 50-1. 99 (m, 4H), 2. 30 (m, 1H), 2. 38 (s

25

, 1. 65H), 2. 39 (s. 1. 35H), 3. 85 (m, 0. 55 H), 3. 98-4. 17 (m, 1. 45H), 4. 23 (m, 1H), 4. 60 (m, 1H), 5. 16 (s, 0. 55H), 5. 25 (d, J = 4. 7Hz, 0. 45H), 7. 18-7. 29 (m, 2H), 7. 3 0-7. 42 (m, 2H).

実施例 4 5 (3 S) - 3 - {(S) - 4 - メチル-2 - (3 - メチルベンゾイルアミノ) バレリルアミノ} - 2 - テトラヒドロフラノール (表 - 1 の化合物番号 1 2 6) の製造

融点:85-87℃

- IR (KBr, cm⁻¹): 3299, 1638, 1586, 1541.

 NMR (CDC1;, δ): 0.83-1.07 (m, 6H), 1.6

 0-1.97 (m, 3H), 2.07 (m, 1H), 2.30 (m, 1H)

), 2.35 (s, 1.8H), 2.36 (s, 1.2H), 3.82 (

 m, 0.6H), 3.96-4.18 (m, 1.6H), 4.18-4.

 15 42 (m, 1.4H), 4.75 (m, 1H), 4.93 (m, 0.4H)

), 5.31 (d, J=2.9Hz, 0.6H), 5.35 (dd, J=4.4Hz, 4.3Hz, 0.4H), 7.01 (m, 1H), 7.14

 (m, 1H), 7.32-7.40 (m, 2H), 7.57-7.67 (m, 2H).
- 20 実施例 4 6 (3 S) 3 {(S) 4 メチル-2 (4 メチルベンゾイルアミノ) バレリルアミノ} 2 テトラヒドロフラノール (表 1 の化合物番号 1 2 7) の製造

融点:101-102℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3304, 1634, 1545, 1504. NMR (CDC1₃, δ): 0. 87-1. 07 (m, 6H), 1. 6 0-1. 95 (m, 4H), 2. 37 (m, 1H), 2. 39 (s, 3H)

), 3. 45 (d, J=2. 9Hz, 0. 6H), 3. 90 (m, 0. 4H), 3. 97-4. 19 (m, 2H), 4. 38 (m, 1H), 4. 71 (m, 1H), 5. 30 (d, J=2. 9Hz, 0. 6H), 5. 35 (dd, J=6. 7Hz, 6. 7Hz, 0. 6H), 6. 74 (d, J=8. 5Hz, 0. 4H), 6. 80 (d, J=8. 5Hz, 1H), 6. 89 (d, J=6. 7Hz, 0. 6H), 7. 22 (d, J=8. 2Hz, 2H), 7. 68 (d, J=8. 2Hz, 2H).

実施例 47 $(3S) - 3 - \{(S) - 2 - (2, 6 - ジメチルベンゾイルアミノ) - 4 - メチルバレリルアミノ} - 2 - テトラヒドロフラノール$

10 (表-1の化合物番号129)の製造

融点:89-91℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3389, 1638, 1539.

NMR (CDC1; , δ): 0. 83-1. 10 (m, 6H), 1. 5 8-1. 99 (m, 4H), 2. 25 (s, 3H), 2. 27 (s, 3H) 15), 2. 32 (m, 1H), 3. 65-3. 93 (m, 1. 55H), 4 . 07 (m, 1H), 4. 22-4. 45 (m, 1. 45H), 4. 70 (m, 1H), 5. 25 (d, J=3. 1Hz, 0. 55H), 5. 31 (dd, J=4. 3Hz, 4. 2Hz, 0. 45H), 6. 36 (d, J=8. 2Hz, 1H), 6. 85-7. 07 (m, 3H), 7. 14 (d) 20 d, J=7. 8Hz, 7. 3Hz, 1H).

実施例 48 $(3S) - 3 - \{(S) - 2 - (3, 4 - ジメチルベンゾイルアミノ) - 4 - メチルバレリルアミノ} - 2 - テトラヒドロフラノール (表 - 1 の化合物番号 <math>130$) の製造

融点:92-94℃

25 IR (KBr, cm⁻¹): 3299, 1636, 1541. NMR (CDC1₃, δ): 0.83-1.10 (m, 6H), 1.5

- 7-1. 99 (m, 4H), 2. 28 (s, 3H), 2. 29 (s, 3H), 2. 34 (m, 1H), 3. 57 (s, 0. 5H), 3. 86 (m,
- 0. 5 H), 3. 97-4. 20 (m, 1. 5 H), 4. 21-4. 45 (m, 1. 5 H), 4. 70 (m, 1 H), 5. 31 (s. 0. 5 H),
- 5 5. 35 (d, J=2. 1Hz, 0. 5H), 6. 74 (d, J=8. 3 Hz, 0. 5H), 6. 80 (d, J=8. 2Hz, 0. 5H), 6. 8 5 (d, J=8. 5Hz, 0. 5H), 6. 93 (d, J=7. 1Hz, 0. 5H), 7. 17 (d, J=7. 8Hz, 1H), 7. 43-7. 6 0 (m, 2H).
- 10 実施例49 (3S) -3-{(S)-4-メチル-2-(2, 4, 6-トリメチルベンゾイルアミノ) バレリルアミノ} -2-テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号131) の製造

融点:150-152℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3295, 1638, 1522.

- NMR (CDC1₃, δ): 0.87-1.07 (m, 6H), 1.5 8-1.97 (m, 4H), 2.18-2.35 (m, 9H), 2.36 (m, 1H), 3.09 (s, 0.45H), 3.48 (s, 0.55H), 3.85 (m, 0.55H), 3.97-4.20 (m, 1.45H)
 -), 4. 35 (m, 1H), 4. 65 (m, 1H), 5. 29 (d, J =
- 20 2. 5 Hz, 0. 4 5 H), 5. 3 4 (dd, J=4. 1 Hz, 3. 8 Hz, 0. 5 5 H), 6. 0 8 (d, J=5. 2 Hz, 1 H), 6. 7 5 (m, 1 H), 6. 8 3 (s, 2 H).

実施例 50 (3S) -3- ((S) -2- (4-エチルベンゾイルアミノ) -4-メチルバレリルアミノ} -2-テトラヒドロフラノール (表-

25 1の化合物番号134)の製造

融点:98-99℃

10

IR (KBr, cm⁻¹): 3304, 1672, 1634, 1545, 1505.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 83-1. 05 (m, 6H), 1. 2 3 (t, J=7. 6Hz, 3H), 1. 60-1. 99 (m, 4H), 2 . 38 (m, 1H), 2. 68 (q, J=7. 6Hz, 2H), 3. 34 (s, 0. 4H), 3. 87 (m, 1H), 4. 00-4. 20 (m, 1 . 6H), 4. 35 (m, 1H), 4. 68 (m, 1H), 5. 30 (s , 0. 6H), 5. 34 (d, J=3. 7Hz, 0. 4H), 6. 65-6. 90 (m, 2H), 7. 21-7. 27 (m, 2H), 7. 69-7 . 74 (m, 2H).

実施例 51 (3S) -3- {(S) -4-メチル-2-(4-トリフル オロメチルベンゾイルアミノ) バレリルアミノ} -2-テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号 137) の製造

融点:135-136℃

IR (KBr, cm⁻¹):3310,1640,1548,1508.

NMR (CDC1₃,δ):0.87-1.07 (m,6H),1.6

1-1.97 (m,4H),2.37 (m,1H),3.43 (s,0.4H),3.82-4.08 (m,1.6H),4.17 (m,1H),
4.29 (m,1H),4.70 (m,1H),5.31 (d,J=2.

20 6Hz,0.4H),5.36 (d,J=4.2Hz,4.2Hz,0.6H),6.71 (d,J=7.9Hz,0.6H),6.73 (d,J=7.9Hz,0.4H),7.03 (d,J=8.3Hz,0.6H),7.14 (d,J=8.3Hz,0.4H),7.61-7.86 (m,2H),7.87-7.93 (m,2H).

実施例52 (3S)-3-{(S)-2-(2-メトキシベンゾイルア

ミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール(表

- 1 の化合物番号 1 3 8) の製造

融点:65-66℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3376, 1640, 1601, 1532.

NMR (CDC1₃, δ): 0.83-1.05 (m, 6H), 1.6

 $5 \quad 0-1$. 95 (m, 4H), 2. 31 (m, 1H), 3. 85 (m, 0.

 $6 \, \text{H}$), 3. 98 (s, 3H), 4. $0 \, 0 - 4$. 20 (m, 1. $6 \, \text{H}$),

4. 24-4. 45 (m, 1. 4H), 4. 69 (m, 1H), 5. 00

(m, 0.4H), 5.34 (m, 1H), 6.93-7.17 (m, 2

. 4H), 7. 22 (m, 0. 6H), 7. 50 (m, 1H), 8. 15

10 (m, 1 H), 8. 30 (m, 1 H).

- 1の化合物番号140)の製造

融点:85-88℃

15 IR (KBr, cm^{-1}): 3295, 1632.

NMR (CDC1: δ): 0. 95 (d, J=6. 0 Hz, 3 H),

0. 96 (d, J = 4. 8 Hz, 3 H), 1. 72 (m, 3 H), 1. 8

6 (m, 1 H), 2. 2 9 (m, 0. 5 H), 2. 4 0 (m, 0. 5 H)

, 3. 84 (s, 3H), 3. 86 (ddd, J=8. 1Hz, 8. 1H

20 z, 8. 1 Hz, 0. 5 H), 4. 0 1 (ddd, J = 8. 1 Hz, 8.

1 Hz, 8. 1 Hz, 0. 5 H), 4. 0 8 (m, 1 H), 4. 2 8 (m

. 0. 5H), 4. 35 (m, 0. 5H), 4. 68 (m, 1H), 5.

30 (s, 0.5H), 5.34 (d, J=4.8Hz, 0.5H), 6

. 71 (d, J=8. 4 Hz, 0. 5 H), 6. 78 (d, J=8. 4 H

z, 0. 5 H), 6. 8 2 (d, J = 8. 1 Hz, 0. 5 H), 6. 9 1

(dd, J=9.0Hz, 2.4Hz, 2H), 6.94(d, J=8.

7 H z, 0, 5 H), 7, 76 (m, 2 H).

実施例 5.4 (3S) $-3-\{(S)-2-(2,4-ジメトキシベンゾイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号 <math>1.4.1$) の製造

5 融点:65-67℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3382, 1638, 1604, 1534.

NMR (CDCl₂, δ): 0.83-1.05 (m, 6H), 1.5

9-1.98 (m, 4H), 2.40 (m, 1H), 3.83 (m, 0.6H), 3.84 (s, 1.2H), 3.86 (s, 1.8H), 3.9

- 10 5 (s, 1.8 H), 3.97 (s, 1.2 H), 4.00-4.21 (m, 2 H), 4.35 (m, 1 H), 4.65 (m, 1 H), 4.80 (m, 0.4 H), 5.32 (d, J=3.2 Hz, 0.6 H), 5.35 (dd, J=4.6 Hz, 4.6 Hz, 0.5 H), 6.48 (s, 0.4 H), 6.49 (s, 0.6 H), 6.59 (m, 1 H), 6.99 (
- 15 d, J = 8. 1 Hz, 0. 6 H), 7. 15 (d, J = 6. 7 Hz, 0. 4 H), 8. 07-8. 22 (m, 2 H).

20 融点:166-168℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3299, 3279, 1645, 1597, 1508.

NMR (DMSO-d6, δ): 0. 87 (d, J=6, 2Hz, 6H), 1. 38-1, 60 (m, 2H), 1. 60-1, 83 (m, 2H)

25 , 2. 15 (m, 1H), 3. 65 (m, 1H), 3. 71 (s, 2. 4 H), 3. 72 (s, 3. 6H), 3. 93 (m, 1H), 4. 10 (m

- , 1 H), 4. 3 9 (m, 1 H), 5. 1 4 (m, 1 H), 6. 5 5 (m, 1 H), 6. 5 8 6. 7 0 (m, 2 H), 7. 1 8 (d, J = 5. 7 Hz, 1 H), 7. 2 9 (m, 1 H), 8. 3 3 (d, J = 8. 4 Hz, 1 H).
- 5 実施例56 (3S)-3-{(S)-2-(3,5-ジメトキシベンゾイルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号144)の製造

融点:88-90℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3407, 1639, 1595, 1539.

- NMR (CDC1₂, δ): 0.83-1.05 (m, 6H), 1.6 0-1.98 (m, 4H), 2.40 (m, 1H), 3.41 (s, 0.6H), 3.70-3.93 (m, 0.8H), 3.79 (s, 6H), 3.95-4.08 (m, 0.6H), 4.10 (m, 1H), 4.25 (m, 1H), 4.65 (m, 1H), 5.30 (d, J=2.2Hz,
- 15 0. 6H), 5. 34 (m, 0. 4H), 6. 58 (dd, J=1. 9H z, 1. 9Hz, 1H), 6. 67-6. 87 (m, 2H), 6. 87-6. 97 (m, 2H).

実施例 5.7 (3S) -3- {(S) -2-(4-エトキシベンゾイルアミノ) -4-メチルバレリルアミノ} -2-テトラヒドロフラノール(表

20 - 1 の化合物番号 1 4 8) の製造

融点:84-85℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3299, 1634, 1609, 1547, 1504.

NMR (CDC1₃, δ): 0.83-1.07 (m, 6H), 1.4 25 3 (t, J=7.0Hz, 3H), 1.60-1.99 (m, 4H), 2 .38 (m, 1H), 3.82 (m, 1H), 3.92-4.20 (m,

3. 5 H), 4. 5 5 (s, 0. 5 H), 4. 6 9 (m, 1 H), 5. 3 1 (d, J=2. 8 Hz, 0. 5 H), 5. 3 5 (dd, J=4. 3 Hz, 4. 1 Hz, 0. 5 H), 6. 8 0 (d, J=8. 3 Hz, 0. 5 H), 6. 8 4-7. 0 0 (m, 3 H), 7. 1 4 (d, J=7. 0 Hz, 0, 5 H), 5 H), 7. 7 6 (d, J=8. 7 Hz, 2 H).

実施例 5 8 (3 S) - 3 - ((S) - 4 - メチル-2 - (3, 4 - メチレンジオキシベンゾイルアミノ) バレリルアミノ) - 2 - テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号 15 2) の製造

融点:94-96℃

- IR (KBr, cm^{-1}): 3410, 3111, 1753, 1659. 10 NMR (CDC1₃, δ): 0. 95 (d, J=6. 0Hz, 3H), 0. 96 (d, J = 5. 1 Hz, 3 H), 1. 69 – 1. 81 (m, 3 H)), 1. 86 (m, 1H), 2. 30 (m, 0. 5H), 2. 41 (m, 0.5H), 3.89 (ddd, J=8.1Hz, 8.1Hz, 8.1Hz, 0. 5 H), 4. 0 5 (d d d, J = 7. 6 H z, 7. 6 H z, 7. 15 6 Hz, 0. 5 H), 4. 1 1 (m, 1 H), 4. 3 0 (m, 0. 5 H) , 4, 36 (m, 0, 5H), 4, 64 (m, 1H), 5, 30 (s, 0 .5H), 5.32 (d, J=4.6Hz, 0.5Hz), 6.02 (s , 2H), 6.61-6.80 (m, 2H), 6.82 (d, J=7.8Hz, 1H), 7, 28 (dd, J=2, 7Hz, 2, 7Hz, 1H), 20 7. 33 (ddd, J = 8. 0 Hz, 2. 0 Hz, 2. 0 Hz, 1 H). 実施例59 ルアミノ) バレリルアミノト -2-テトラヒドロフラノール(表-1の化 合物番号156)の製造
- 25 融点: 85-86℃ IR(KBr, cm⁻¹): 3293, 1638, 1535.

NMR (CDC1;, δ): 0. 83-1. 05 (m, 6H), 1. 5 9-1. 99 (m, 4H), 2. 38 (m, 1H), 3. 47 (s, 0. 45H), 3. 88 (m, 1H), 3. 94-4. 20 (m, 1. 55H), 4. 38 (m, 1H), 4. 80 (m, 1H), 5. 29 (d, J= 2. 9Hz, 0. 55H), 5. 35 (dd, J=4. 4Hz, 3. 9H), 6. 64 (d, J=8. 2Hz, 0. 55H), 6. 73 (d, J=8. 1Hz, 0. 45H), 6. 89 (m, 1H), 7. 44 (m, 1H), 7. 47-7. 68 (m, 3H), 7. 80-7. 9 7 (m, 2H), 8. 25 (m, 1H).

10 実施例 6 0 (3 S) - 3 - {(S) - 4 - メチル - 2 - (2 - ナフトイルアミノ) バレリルアミノ} - 2 - テトラヒドロフラノール (表 - 1 の化合物番号 1 5 7) の製造

融点:98-100℃

物番号161)の製造

IR (KBr, cm⁻¹):3293,1640,1539,1512.

NMR (CDCl,, δ):0.83-1.13 (m, 6H),1.6
0-1.99 (m, 4H),2.36 (m, 1H),3.53 (s, 0.3H),3.85 (m, 0.7H),3.99-4.21 (m, 2H),
4.40 (m, 1H),4.80 (m, 1H),5.34 (dd, J=4.4tz,4.3Hz,0.3H),5.38 (d, J=2.7Hz,0.7H),6.88 (d, J=8.5Hz,0.7H),6.96 (d, J=7.2Hz,0.3H),7.04 (d, J=8.3Hz,0.7H),7.12 (d, J=8.2Hz,0.3H),7.43-7.64 (m,2H),7.79-7.97 (m,4H),8.32 (s,1H).

実施例61 (3S)-3-{(S)-2-(2-フロイルアミノ)-4.25 -メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノール (表-1の化合

融点:92-95℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3420, 3300, 1645, 1595, 1529.

NMR (CDC1,, δ): 0.85-1.05 (m, 6H), 1.5
8-2.00 (m, 4H), 2.25-2.55 (m, 1H), 3.52
(d, J=2.7Hz, 0.55H), 3.87 (dt, J=7.8Hz, 7.8Hz, 0.55H), 3.95-4.17 (m, 1.9H), 4.27-4.45 (m, 1H), 4.45-4.73 (m, 1H), 5.31 (d, J=2.7Hz, 0.55H), 5.35 (dd, J=4.0Hz, 4.0Hz, 0.45H), 6.51 (dd, J=3.1Hz, 1Hz, 4.0Hz, 0.45H), 6.51 (dd, J=3.1Hz, 1Hz, 4.0Hz, 0.45H), 6.51 (dd, J=3.1Hz, 1Hz, 4.0Hz, 4.0Hz, 0.45H), 6.51 (dd, J=3.1Hz, 4.0Hz, 4.0H

. 4 Hz, 1 H), 6. 7 7 (d, J=7. 7 Hz, 1 H), 6. 8 0 - 6. 9 3 (m, 1 H), 7. 1 4 (dd, J=3. 1 Hz, 1. 9 Hz, 1 H), 7. 4 6 (dd, J=1. 9 Hz, 1. 4 Hz, 1 H).

実施例62 (3S)-3-{(S)-2-(3-エチル-1-メチル-

15 5-ピラゾール) カルボニルアミノー4-メチルバレリルアミノ - 2-テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号170) の製造

融点:89-91℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3301, 1643.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 97 (d, J=5. 0Hz, 6H),

- 1. 23 (t, J=7. 7Hz, 2. 1H), 1. 23 (t, J=7. 6 Hz, 0. 9H), 1. 60-1. 90 (m, 4H), 2. 34 (m, 0 . 7H), 2. 56 (m, 0. 3H), 2. 62 (q, J=7. 6Hz, 2H), 3. 89 (ddd, J=7. 8Hz, 7. 8Hz, 7. 8Hz,
 - 1 H), $4. \ 0 \ 1 \ \ 4. \ 1 \ 7 \ (m, \ 2 \ H)$, $4. \ 0 \ 8 \ (s, \ 0. \ 9 \ H)$,
- 25 4. 08 (s, 2. 1H), 4. 35 (m, 1H), 4. 58 (m, 1H), 5. 29 (s, 0. 3H), 5. 35 (d, J=3. 9Hz, 0. 7

H), 6. 39 (s, 1H), 6. 44 (d, J = 6. 8Hz, 0. 3H), 6. 55 (d, J = 8. 4Hz, 0. 7H), 6. 60 (d, J = 8. 4Hz, 1H).

実施例63 (3S) -3- {(S) -2-(2-クロマンカルボニルア
 5 ミノー4-メチルバレリルアミノ} -2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号175)の製造

融点:84-85℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3299, 1786, 1532.

NMR (CDC1₂, δ): 0. 78-0. 93 (m, 3H), 0. 9

5-1. 05 (m, 3H), 1. 35-2. 07 (m, 5H), 2. 20

-2. 54 (m, 2H), 2. 70-3. 00 (m, 2H), 3. 80
4. 20 (m, 2H), 4. 24-4. 60 (m, 3H), 5. 15 (m, 1H), 5. 31 (m, 1H), 6. 40 (m, 1H), 6. 65 (m, 1H), 6. 83-6. 97 (m, 2H), 6. 98-7. 20 (m,

実施例 64 (3S) -3-((S) -2-シンナモイルアミノー4-メチルバレリルアミノ) -2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号 182) の製造

融点:102-104℃

2H).

15

IR (KBr, cm⁻¹): 3293, 1651, 1624, 1543.

NMR (CDC1₃, δ): 0.96 (m, 6H), 1.63-1.9

2 (m, 4H), 2.32 (m, 0.5H), 2.47 (m, 0.5H),

3.35 (d, J=2.7Hz, 0.5H), 3.43 (d, J=2.7Hz, 0.5H), 3.43 (d, J=2.7Hz, 0.5H), 4.34 (m, 1H), 4.02-4.18 (m, 2H), 4.34 (m, 1H), 4.62 (m, 1H), 5.31 (s, 0.5H), 5.35 (m, 0.5H), 6.43 (d, J=15.0H)

z, 1 H), 6. 4 4 (m, 1 H), 6. 9 0 (m, 1 H), 7. 3 2 (m, 2 H), 7. 5 1 (m, 2 H), 7. 6 2 (m, 1 H).

5 表-1の化合物番号187)の製造

融点:101-103℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3283, 1651, 1602, 1543, 1512.

NMR (CDC1₃, δ): 0.85-1.05 (m, 6H), 1.6

10 0-1.99 (m, 4H), 2.30 (m, 1H), 3.77 (s, 1.5H), 3.79 (s, 1.5H), 3.82 (m, 0.5H), 4.1

0 (m, 1H), 4.30 (m, 0.5H), 4.41 (m, 1H), 4.72 (m, 1H), 5.35 (m, 1H), 6.38 (d, J=15.6Hz, 0.5H), 6.41 (d, J=15.6Hz, 0.5H), 6.

15 .65-6.85 (m, 2H), 6.90 (d, J=8.5Hz, 0.5H), 7.15 (d, J=8.5Hz, 0.5H), 7.20 (d, J=8.5Hz, 0.5H), 7.15 (d, J=8.5Hz, 0.5H), 7.20 (d, J=8.5Hz, 0.5H), 7.43 (dd, J=8.8Hz, 3.1Hz, 2H), 7.49 (d, J=8.5Hz, 0.5H), 7.58 (d, J=15.6Hz, 0.5H), 7.59 (d, J=15.6Hz, 0.

実施例 6.6 (3.S) -3.- $\{(S)$ -2.- (4.- -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2. -2.

融点:156-158℃

5H).

20

25 IR (KBr, cm⁻¹): 3347, 3256, 1649, 1593, 1541.

NMR (DMSO-d6, δ): 0. 71 (d, J=6.5 Hz, 3 H), 0. 80 (d, J=6.6 Hz, 3 H), 1. 28 (m, 2 H), 1. 45-1.68 (m, 2 H), 1. 86 (m, 1 H), 3. 60-3. 95 (m, 4 H), 4. 98 (dd, J=4.4 Hz, 4.1 Hz, 1 H), 6. 37 (d, J=4.1 Hz, 1 H), 7. 39 (dd, J=8.8 Hz, 8.3 Hz, 2 H), 7. 75 (d, J=7.5 Hz, 1 H), 7. 81 (dd, J=8.8 Hz, 5.3 Hz, 2 H), 8. 00 (d, J=9.0 Hz, 1 H).

IR (KBr, cm⁻¹): 3365, 1657, 1541.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 65 (d, J=6. 2Hz, 1. 2H), 0. 67 (d, J=6. 4Hz, 1. 8H), 0. 82 (d, J=6)

15 . 1Hz, 1. 2H), 0. 84 (d, J=6. 4Hz, 1. 8H), 1
 . 43-1. 72 (m, 4H), 2. 13 (m, 0. 6H), 2. 36 (m, 0. 4H), 3. 62-4. 28 (m, 5H), 5. 24 (d, J=3. 0Hz, 0. 4H), 5. 31 (dd, J=3. 8Hz, 3. 8Hz, 0. 6H), 5. 91 (d, J=8. 8Hz, 0. 4H), 5. 94 (d, J=7. 5Hz, 0. 4H), 6. 65 (d, J=8. 1Hz, 0. 6H), 7. 38-7. 4

5 (m, 1H), 7. 45-7. 60 (m, 2H), 8. 06 (dd, J=6. 2Hz, 1. 2

実施例68 (3S)-3-{(S)-2-(4-クロロフェニルスルホ 25 ニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-テトラヒドロフラノー ル(表-1の化合物番号205)の製造

= 7.3 Hz, 1.1 Hz, 1 H).

融点:112-115℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3335, 3264, 1649.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 76 (d, J=6. 3Hz, 0. 6H

-), 0. 80 (d, J=6. 3Hz, 2. 4H), 0. 87 (d, J=6
- 5 . 9 Hz, 0. 6 H), 0. 8 9 (d, J = 6. 6 Hz, 2. 4 H), 1
 - . 48 (m, 3H), 1. 68 (m, 1H), 2. 11 (m, 0.8H)
 - , 2. 40 (m, 0. 2H), 3. 67 (ddd, J=6. 9Hz, 6.
 - 9 H z, 6, 9 H z, 1 H), 3, 8 5 (m, 0, 8 H), 3, 9 4 (m
 - , 0. 2H), 4. 05-4. 21 (m, 2H), 5. 18 (s. 0. 2
- 10 H), 5. 25 (d, J=4. 5Hz, 0.8H), 5. 31 (d, J=
 - 9. 9Hz, 0. 2H), 5. 35(d, J=8.4Hz, 0.8H),
 - 5. 94 (d, J = 7. 8 Hz, 0. 2 H), 6. 23 (d, J = 7. 8
 - Hz, 0.8H), 7.48 (d, J=8, 4Hz, 2H), 7.80 (
 - d, J = 8. 4 Hz, 2 H).
- 15 実施例 6 9 (3 S) 3 {(S) 2 (4 プロモフェニルスルホニルアミノ) 4 メチルバレリルアミノ} 2 テトラヒドロフラノール (表-1 の化合物番号 2 0 8) の製造

融点:139-140℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3478, 3362, 3264, 1647,

20 1 5 7 6, 1 5 3 7.

NMR (DMSO-d6, δ): 0. 63-0. 90 (m, 6H), 1

- 15-1.42 (m, 2H), 1.42-1.66 (m, 2H), 1.
- 83 (m, 0. 65H), 2. 02 (m, 0. 35H), 3. 45-3.
- 92 (m, 4H), 4.80 (d, J=4.1Hz, 0.35H), 4.
- 25 96 (dd, J=4. 4Hz, 4. 4Hz, 0. 65H), 6. 10 (d
 - , J = 4. 1 Hz, 0. 35 H), 6. 36 (d, J = 4. 4 Hz, 0.

65H), 7. 60-7. 85 (m, 4. 65H), 7. 95-8. 15 (m, 1. 35H).

実施例70 (3S) -3- {(S) -4-メチル-2-(4-メチルフェニルスルホニルアミノ) バレリルアミノ} -2-テトラヒドロフラノー

5 ル (表-1の化合物番号211)の製造

融点:137-138℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3343, 3264, 1649, 1541. NMR (DMSO-d6, δ): 0. 66 (d, J=6, 5Hz, 0.9H), 0. 74 (d, J=6, 7Hz, 3H), 0. 80 (d, J=6

10 . 7Hz, 2. 1H), 1. 10-1. 40 (m, 3H), 1. 53 (m, 1H), 1. 85 (m, 0. 3H), 1. 98 (m, 0. 7H), 2. 35 (s, 3H), 3. 51 (m, 0. 7H), 3. 58-3. 85 (m, 3. 3H), 4. 78 (d, J=4. 4Hz, 0. 7H), 4. 96 (m, 0. 3H), 6. 07 (d, J=4. 4Hz, 0. 7H), 6. 39 (d, J=3. 9Hz, 0. 3H), 7. 31 (d, J=7. 9Hz, 2)

H), 7. 61 (d, J=7. 9Hz, 2H), 7. 66 (d, J=6. 2Hz, 0. 3H), 7. 80 (m, 1H), 7. 92 (d, J=6. 4 Hz, 0. 7H).

実施例71 (3S)-3-{(S)-4-メチル-2-(2, 4, 6-20 トリメチルフェニルスルホニルアミノ) バレリルアミノ} -2-テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号215) の製造

融点:75-77℃

25

IR (KBr, cm⁻¹): 3328, 1657, 1605, 1541. NMR (CDC1;, δ): 0. 67 (d, J=6. 3Hz, 1. 35 H), 0. 68 (d, J=6. 3Hz, 1. 65H), 0. 83 (d, J=6. 4Hz, 1. 35H), 0. 84 (d, J=6. 4Hz, 1. 65

- H), 1. 38-1. 72 (m, 4H), 2. 11 (m, 0. 65H), 2. 29 (s, 3H), 2. 31 (m, 0. 45H), 2. 63 (s, 6 H), 3. 61 (m, 1H), 3. 72 (d, J=3. 0Hz, 0. 45 H), 3. 74-3. 98 (m, 1H), 3. 98-4. 24 (m, 2. 55H), 5. 23 (d, J=3. 0Hz, 0. 45H), 5. 28 (d, J=3. 9Hz, 3. 9Hz, 0. 55H), 5. 46 (d, J=8. 6Hz, 0. 45H), 5. 60 (d, J=8. 0Hz, 0. 55H), 6. 38 (d, J=7. 4Hz, 0. 45H), 6. 54 (d, J=8.
- 10 実施例 72 $(3S) 3 \{(S) 2 (4 tert プチルフェ$ $ニルスルホニルアミノ) - 4 - メチルバレリルアミノ} - 2 - テトラヒド$ ロフラノール (表 - 1 の化合物番号 <math>218) の製造

0 Hz, 0. 55H), 6. 95 (s, 2H).

融点:140-141℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3362, 3161, 1647, 1535.

- NMR (DMSO-d6, δ): 0. 74 (d, J=6. 5Hz, 3H), 0. 81 (d, J=6. 6Hz, 3H), 1. 15-1. 41 (m, 3H), 1. 29 (s, 9H), 1. 54 (m, 1H), 1. 95 (m, 1H), 3. 46 (m, 1H), 4. 62-4. 82 (m, 3H), 4. 80 (d, J=4. 3Hz, 1H), 6. 06 (d, J=4. 3Hz, 1
- 20 H), 7. 53 (d, J=8. 5Hz, 2H), 7. 66 (d, J=8. 5Hz, 2H), 7. 82 (d, J=9. 4Hz, 1H), 7. 95 (d, J=6. 7Hz, 1H).

実施例73 (3S) -3- {(S) -2-(4-メトキシフェニルスルホニルアミノ) -4-メチルバレリルアミノ} -2-テトラヒドロフラノ

25 ール (表 - 1 の化合物番号 2 2 1) の製造

融点:153-155℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3362, 3150, 1647, 1597, 1535, 1501.

NMR (DMSO-d6, δ): 0. 69 (m, 0. 6H), 0. 76 (d, J=6. 5Hz, 2. 7H), 0. 82 (d, J=6. 7Hz, 2. 7H), 1. 15-1. 45 (m, 3H), 1. 56 (m, 1H), 2. 01 (m, 1H), 3. 54 (m, 1H), 3. 60-3. 90 (m, 3H), 3. 81 (s, 3H), 4. 89 (d, J=4. 6Hz, 0. 9H), 4. 99 (m, 0. 1H), 6. 09 (d, J=4. 6Hz, 0. 9H), 6. 41 (d, J=2. 7Hz, 0. 1H), 7. 04 (d, J=8. 8Hz, 2H), 7. 60-7. 80 (m, 3. 1H), 7. 94 (d, J=6. 9Hz, 0. 9H).

実施例 74 (3S) -3- {(S) -4-メチル-2-(3-ニトロフェニルスルホニルアミノ) バレリルアミノ} -2-テトラヒドロフラノール (表-1 の化合物番号 2 2 7) の製造

融点: 164-165°C
 IR (KBr, cm⁻¹): 3358, 3264, 1649, 1537.
 NMR (DMSO-d6, δ): 0. 73-0. 95 (m, 6H), 1
 . 20-1. 80 (m, 4. 75H), 1. 95 (m, 0. 25H), 3
 . 47-3. 65 (m, 2H), 3. 77 (m, 1H), 3. 94 (m,
20 1H), 4. 73 (d, J=2. 7Hz, 0. 25H), 4. 92 (dd , J=4. 1Hz, 4. 1Hz, 0. 75H), 6. 06 (d, J=2. 7Hz, 0. 25H), 6. 29 (d, J=4. 1Hz, 0. 75H), 7. 80-7. 95 (m, 2H), 8. 05-8. 21 (m, 1. 25H), 8. 35 (d, J=8. 4Hz, 0. 75H), 8. 46 (d, J=2).

実施例75 (3S) - 3 - {(S) - 4 - メチルー2 - (1 - ナフチル

スルホニルアミノ) バレリルアミノ - 2 - テトラヒドロフラノール (表 - 1 の化合物番号 2 2 9) の製造

融点:89-91℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3580, 3520, 3470, 3281,

5 1647, 1553.

NMR (DMSO-d6, δ): 0. 34 (d, J=6.0Hz, 1.95H), 0. 51 (d, J=6.2Hz, 1.05H), 0. 62 (d, J=6.1Hz, 1.95H), 0. 71 (d, J=6.4Hz, 1.05H), 1.10-1.60 (m, 4H), 1.75-1.95 (m,

- 10 1 H), 3. 47-3. 83 (m, 4H), 4. 73 (d, J=4. 5 H)
 z, 0. 35 H), 4. 94 (dd, J=4. 3 Hz, 4. 3 Hz, 0.
 65 H), 6. 03 (d, J=4. 5 Hz, 0. 35 H), 6. 34 (d)
 , J=4. 3 Hz, 0. 65 H), 7. 50-7. 75 (m, 4 H), 7
 . 86 (d, J=8. 2 Hz, 0. 35 H), 7. 98-8. 32 (m,
- 3.65H), 8.66(d, J=7.4Hz, 1H).
 実施例76 (3S)-3-{(S)-4-メチル-2-(2-ナフチルスルホニルアミノ) バレリルアミノ) -2-テトラヒドロフラノール(表-1の化合物番号230)の製造

融点:102-104℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3351, 1655, 1541.

NMR (DMSO-d6, δ): 0. 65 (d, J=6. 4Hz, 1.

5H), 0. 65-0. 90 (m, 4. 5H), 1. 14-1. 68 (m, 5H), 3. 25 (m, 0. 5H), 3. 57-3. 91 (m, 3. 5H), 4. 73 (s, 0. 5H), 4. 89 (dd, J=4. 3Hz, 4)

25 . 3Hz, 0. 5H), 5. 98 (s, 0. 5H), 6. 32 (d, J=4. 3Hz, 0. 5H), 7. 60-7. 80 (m, 3. 5H), 7. 9

3 (d, J=6.7Hz, 0.5H), 7.98-8.17 (m, 4H), 8. 38 (d, J=8.3Hz, 1H).

実施例 77 (3S) -3- {(S) -4-メチルー2-(3-ピリジルスルホニルアミノ) バレリルアミノ} -2-テトラヒドロフラノール(表

5 - 1 の化合物番号 2 3 2) の製造

融点:127-130℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3268, 1647.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 79 (d, J=6. 3Hz, 0. 6H), 0. 84 (d, J=6. 6Hz, 2. 4H), 0. 86 (d, J=6)

10 .0Hz, 0. 6H), 0. 90 (d, J=6. 6Hz, 2. 4H), 1

.49-1. 61 (m, 3H), 1. 71 (m, 1H), 2. 09 (m, 0. 8H), 2. 37 (m, 0. 2H), 3. 78-3. 87 (m, 1. 8H), 3. 96 (q, J=6. 6Hz, 0. 2H), 4. 05-4. 1

- 5 (m, 2H), 5. 17 (s, 0. 2H), 5. 22 (d, J=4. 8 15 Hz, 0. 8Hz), 5. 75 (d, J=8. 7Hz, 0. 8H), 5.
- 79 (d, J=9. 3Hz, 0. 2H), 6. 13 (d, J=6. 6Hz, 0. 2H), 6. 36 (d, J=8. 1Hz, 0. 8H), 7. 45 (
 - dd, J=7. 8Hz, 4. 8Hz, 1H), 8. 17 (ddd, J=7
- 8 Hz, 1. 8 Hz, 1. 8 Hz, 1 H), 8. 80 (dd, J=4.
- 20 8 H z, 1, 2 H z, 1 H), 9, 0 7 (d, J=2, 1 H z, 1 H). 実施例 7 8 (3 S) - 3 - ((S) - 2 - ベンジロキシカルボニルアミ ノ-3-フェニルプロピオニルアミノ) - 2 - テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号 2 4 6)の製造

融点:144-146℃

25 IR (KBr, cm⁻¹): 3302, 1696, 1649, 1537. NMR (CDC1₃, δ): 1.69 (m, 1H), 2.20-2.4

1 (m, 1 H), 2. 60 (s, 0. 8 H), 2. 82 (s, 0. 2 H), 2. 97 (dd, J=14. 7 Hz, 7. 8 Hz, 1 H), 3. 13 (m, 1 H), 3. 81 (ddd, J=7. 8 Hz, 7. 8 Hz, 7. 8 Hz, 7. 8 Hz, 0. 8 H), 4. 02 (m, 1. 2 H), 4. 26 (m, 1 H), 4 . 37 (m, 1 H), 5. 09 (m, 3 H), 5. 40 (s, 1 H), 5 . 70 (s, 0. 2 H), 6. 08 (s, 0. 8 H), 7. 33 (m, 1 0 H).

実施例 7 9 (3 S) - 3 - ((S) - 2 - ベンジロキシカルボニルアミ ノー 3 - t e r t - ブトキシプロピオニルアミノ) - 2 - テトラヒドロフ 10 ラノール (表-1 の化合物番号 2 9 7) の製造

IR (KBr, cm⁻¹): 3322, 1719, 1661, 1534.

NMR (CDC1₃, δ): 1. 17 (s, 9H), 1. 69-1. 9

8 (m, 1H), 2. 30 (m, 0. 6H), 2. 44 (m, 0. 4H)

, 3. 40 (m, 1H), 3. 62-3. 98 (m, 3H), 4. 11 (
m, 1H), 4. 22 (m, 1H), 4. 35 (m, 1H), 5. 11 (
s, 2H), 5. 22 (s, 0. 4H), 5. 29 (s, 0. 6H), 5

. 76 (s, 1H), 6. 80 (s, 0. 4H), 7. 08 (bs, 0. 6H), 7. 35 (m, 5H).

実施例 8 0 (3 S) - 4 - メチル-3 - ((S) - 4 - メチル-2 - フ 20 ェニルスルホニルアミノバレリルアミノ) - 2 - テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号 3 2 0) の製造

融点:116-121℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3356, 3272, 1655.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 70 (d, J=6. 0 Hz, 2. 1 H 25), 0. 71 (d, J=6. 0 Hz, 0. 9 H), 0. 86 (d, J=6 . 6 Hz, 3 H), 0. 95 (d, J=6. 6 Hz, 2. 1 H), 1. 0 4 (d, J=6.6Hz, 0.9H), 1.50 (m, 2H), 1.62 (m, 1H), 2.12 (m, 1H), 3.43 (m, 1H), 3.70 (m, 1H), 3.91 (m, 1H), 4.17 (dd, J=8.4Hz, 8.4Hz, 1H), 5.12 (d, J=4.5Hz, 0.3H), 5.25 (d, J=4.5Hz, 0.7H), 5.35 (d, J=7.2Hz, 0.7H), 5.40 (d, J=7.2Hz, 0.3H), 6.34 (d, J=8.7Hz, 0.3H), 6.37 (d, J=8.7Hz, 0.7H), 7.49-7.62 (m, 3H), 7.88 (m, 2H). 実施例81 (3S)-3-((S)-2-ベンジロキシカルボニルアミ

10 ノー4ーメチルバレリルアミノ) -2-テトラヒドロピラゾール (表-1 の化合物番号433) の製造

IR (KBr, cm⁻¹): 3298, 1691, 1649, 1541.

NMR (CDC1₃, δ): 0.90-0.92 (m, 6H), 1.5

7-1.70 (m, 7H), 3.43-3.70 (m, 2H), 3.87

15 -3.99 (m, 2H), 4.08-4.12 (m, 1H), 5.02 (
s, 0.4H), 5.08 (s, 1.6H), 5.66 (s, 1H), 6

.57 (s, 0.8H), 6.88 (s, 0.2H), 7.31 (s, 5H).

実施例82 (3S)-3-{(S)-2-(2-フルオロベンゾイルア 20 ミノ)-4-メチルバリレルアミノ}-2-テトラヒドロピラゾール(表 -1の化合物番号450)の製造

IR (KBr, cm⁻¹): 3408, 1600, 1495.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 92-0. 98 (m, 6H), 1. 6 4-1. 82 (m, 7H), 3. 48-3. 59 (m, 2H), 3. 84 25 -4. 13 (m, 2H), 4. 68-4. 70 (m, 1H), 5. 01 (m, 0. 3H), 5. 05 (m, 0. 7H), 6. 55 (d, J=8. 3 Hz, 0. 7H), 6. 82 (d, J=8. 2Hz, 0. 3H), 7. 0 7-7. 28 (m, 2H), 7. 41-7. 52 (m, 1H), 7. 99 -8. 05 (m, 1H).

実施例83 (3S)-3-((S)-4-メチル-2-フェニルスルホ
 ニルアミノバレリルアミノ)-2-テトラヒドロピラノール (表-1の化合物番号468)の製造

融点:156-157℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3335, 3261, 1649, 1545. NMR (CDC1₃, δ): 0. 67 (d, J=8. 5Hz, 3H),

- 10 0. 85 (d, J=6. 0 Hz, 3 H), 1. 21-2. 05 (m, 7 H), 3. 21 (d, J=4. 1 Hz, 0. 8 H), 3. 41-3. 78 (m, 2 H), 3. 80-4. 07 (m, 2 H), 4. 19 (m, 0. 2 H), 4. 95 (s, 1 H), 5. 23 (d, J=6. 8 Hz, 1 H), 6. 26 (m, 1 H), 7. 42-7. 68 (m, 3 H), 7. 87 (d,
- 15 J = 8.5 Hz.2 H).

実施例 84 (3S) -3- {(S) -4-メチル-2-(2, 4, 6 -トリメチルフェニルスルホニルアミノ) バレリルアミノ} -2-テトラヒドロピラノール (表-1 の化合物番号 473) の製造

IR (KBr, cm⁻¹):3331, 1655, 1541.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 66-0. 72 (m, 3H), 0. 8 3-0. 85 (m, 3H), 1. 44-1. 97 (m, 7H), 2. 28 (s, 3H), 2. 63 (s, 6H), 3. 42-3. 75 (m, 2H) , 3. 84-3. 98 (m, 2H), 4. 40-4. 47 (m, 1H), 4. 93 (s, 1H), 5. 47 (d, J=8. 4Hz, 0. 3H), 5 25 . 53 (d, J=7. 8Hz, 0. 7H), 6. 34 (m, 1H), 6. 94 (s, 2H).

融点:49-51℃

- 5 IR (KBr, cm⁻¹): 3414, 1701, 1674, 1524.

 NMR (CDC1₃, δ): 0. 81-1. 04 (m, 6H), 1. 5

 4-2. 02 (m, 4H), 2. 19-2. 55 (m, 1H), 2. 25

 (s, 1. 95H), 2. 29 (s, 1. 05H), 2. 46 (s, 3H), 2. 85 (d, J=2. 9Hz, 0. 35H), 3. 23 (d, J=
- 10 3. 2 H z, 0. 6 5 H), 3. 8 0 4. 2 0 (m, 2 H), 4. 2 7 - 4. 4 4 (m, 1 H), 4. 8 6 (t, J=7. 7 H z, 0. 3 5 H) , 4. 9 7 (dd, J=7. 7 H z, 6. 3 H z, 0. 6 5 H), 5. 2 4 (d, J=2. 9 H z, 0. 3 5 H), 5. 3 4 (dd, J=3. 2 H z, 3. 2 H z, 0. 6 5 H), 6. 0 2 (d, J=7. 4 H z, 0. 3
- 5H), 6. 41 (d, J=7. 9Hz, 0. 65H), 7. 37 (d, J=8. 4Hz, 2H), 7. 98 (d, J=8. 4Hz, 0. 7H), 8. 05 (d, J=8. 4Hz, 1. 3H).

20 テトラヒドロフラノール (表-1の化合物番号516) の製造

融点:48-51℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3414, 1701, 1595, 1522, 1501.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 84-1. 06 (m, 6H), 1. 5 25 7-2. 01 (m, 4H), 2. 24 (s, 1. 95H), 2. 29 (s , 1. 05H), 2. 26-2. 58 (m, 1H), 3. 04 (d, J= 2. 6 Hz, 0. 3 5 H), 3. 4 2 (d, J=3. 1 Hz, 0. 6 5 H), 3. 8 0 - 4. 1 8 (m, 2 H), 3. 8 9 (s, 1. 9 5 H), 3. 9 0 (s, 1. 0 5 H), 4. 2 4 - 4. 4 3 (m, 1 H), 4. 8 7 (dd, J=7. 7 Hz, 6. 0 Hz, 0. 3 5 H), 4. 9 5 (t, J) 5 = 6. 9 Hz, 0. 6 5 H), 5. 2 4 (d, J=2. 6 Hz, 0. 3 5 H), 5. 3 4 (dd, J=3. 1 Hz, 3. 1 Hz, 0. 6 5 H), 6. 0 4 (d, J=7. 1 Hz, 0. 3 5 H), 6. 4 2 (d, J=8. 0 Hz, 0. 6 5 H), 7. 0 4 (d, J=9. 0 Hz, 2 H), 8. 0 4 (d, J=9. 0 Hz, 0. 7 H), 8. 1 2 (d, J=9. 0 Hz, 1 0 . 3 H).

実施例87 (3S)-3-{(S)-2-((S)-4-メチル-2-フェニルスルホニルアミノバリレルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ }-2-テトラヒドロフラノール(表-3の化合物番号1126)の製造 融点:186-188℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3285, 1644, 1549.

NMR (CDC1₃, δ): 0.40 (d, J=6.3Hz, 1.2H), 0.52 (d, J=5.6Hz, 1.8H), 0.75-1.00 (m, 9H), 1.32-2.07 (m, 7H), 2.25 (m, 0.6H), 2.40 (m, 0.4H), 3.48 (d, J=2.8Hz, 0.4H), 3.59 (m, 1H), 3.73-3.92 (m, 1.2H), 4.02-4.20 (m, 1.4H), 4.21-4.56 (m, 2H), 5.30-5.38 (m, 1H), 5.59 (d, J=4.8Hz, 0.4H), 5.68 (d, J=5.9Hz, 0.6H), 6.82 (d, J=8.3Hz, 0.6H), 6.95 (d, J=9.7Hz, 0.4H)

25 .6.99 (d, J=8.6Hz, 0.6H), 7.08 (d, J=7.0Hz, 0.4H), 7.47-7.72 (m, 3H), 7.91 (d, 0.4H)

J = 8.5 Hz.2 H).

実施例88 (2S, 3S) - 2-アセトキシ-3-((S) - 4-メチル-2-フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ) テトラヒドロフラン(表-2の化合物番号716) の製造

参考例1で得られた(S)-3-((S)-4-メチル-2-フェニル 5 スルホニルアミノバレリルアミノ) -2-テトラヒドロフラノン244m gを塩化メチレン35m1に溶解して-78℃に冷却し、1.01mo1 /1の水素化ジイソプチルアルミニウムのトルエン溶液1. 91m1を加 えた。-78℃で3時間撹拌した後、反応液に飽和塩化アンモニウム水溶 液および酢酸エチルを加え、室温に戻したのちセライトで濾過し、セライ 10 トを酢酸エチルでよく洗浄した。濾液を飽和食塩水で洗浄後、硫酸マグネ シウムで乾燥してからこれを濾過した。濾液を濃縮し、粗な(3S)-3 - ((S)-4-メチル-2-フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ) -2-テトラヒドロフラノール (実施例1の化合物)を得た。これをピ リジン1mlに溶かし、氷冷下無水酢酸1.5mlを加えてから氷冷下で 15 9時間撹拌した後、メタノール1.5mlを加え濃縮した。得られた残渣 を酢酸エチルに溶解し、希塩酸、水、飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄 し、硫酸マグネシウムで乾燥してからこれを濾過した。濾液を濃縮し、得 られた残渣に酢酸エチル2.5m1およびヘキサン2.5m1を加え撹拌 し、生成した結晶を濾取し目的物120mgを得た。 20

収率:44%

融点:177-178℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3409, 3100, 1753, 1659. NMR (CDC1₂, δ): 0. 54 (d, J=6, 3Hz, 3H),

25 0.80 (d, J=6.3Hz, 3H), 1.37 (m, 2H), 1.5 9 (m, 1H), 1.81 (m, 1H), 2.16 (s, 3H), 2.2 4 (m, 1 H), 3, 6 1 (m, 1 H), 3, 9 5 (ddd, J=9, 3 Hz, 9, 0 Hz, 7, 5 Hz, 1 H), 4, 1 4 (ddd, J=9, 3 Hz, 9, 3 Hz, 3, 0 Hz, 1 H), 4, 5 3 (m, 1 H), 4, 8 7 (d, J=6, 6 Hz, 1 H), 6, 1 6 (d, J=4, 5 Hz, 1 H), 6, 5 6 (d, J=8, 7 Hz, 1 H), 7, 5 4 (m, 2 H), 7, 6 2 (m, 1 H), 7, 8 6 (dd, J=7, 2 Hz, 1, 5 Hz, 2 H).

実施例88と同様の方法により、以下実施例89から実施例117の化合物を製造した。以下、その物性値を記す。

10 実施例89 (2S, 3S) - 2-アセトキシ-3-((S) - 2-tert-ブトキシカルボニルアミノ-4-メチルバリレルアミノ)テトラヒドロフラン(表-2の化合物番号547)の製造

融点:143-145℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3297, 1748, 1659.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 93 (d, J=6. 0Hz, 3H),
0. 94 (d, J=6. 0Hz, 3H), 1. 45 (s, 9H), 1. 4
9 (m, 1H), 1. 67 (m, 2H), 1. 83 (m, 1H), 2. 1
1 (s, 3H), 2. 36 (m, 1H), 3. 96 (ddd, J=9. 3
Hz, 9. 3Hz, 9. 3Hz, 1H), 4. 06 (m, 1H), 4. 1
20 4 (ddd, J=9. 3Hz, 9. 3Hz, 3. 0Hz, 1H), 4. 5
7 (m, 1H), 4. 84 (s, 1H), 6. 17 (s, J=4. 8Hz, 1H), 6. 45 (s, 1H).

実施例 9 0 (2 S, 3 S) - 2 - アセトキシ - 3 - ((S) - 2 - ベンジロキシカルボニルアミノ - 4 - メチルバレリルアミノ) テトラヒドロフラン (表 - 2 の化合物番号 5 5 1) の製造

融点:162-164℃

25

1535.

IR (KBr, cm⁻¹): 3310, 1687, 1655, 1535.

NMR (CDC1;, δ): 0. 94 (d, J=6. 2Hz, 3H),

0. 95 (d, J=6. 2Hz, 3H), 1. 83 (m, 1H), 2. 0

7 (s, 3H), 2. 11 (m, 3H), 2. 36 (m, 1H), 3. 9

3 (ddd, J=7. 8Hz, 7. 8Hz, 7. 8Hz, 1H), 4. 0

9 (m, 2H), 4. 79 (m, 1H), 5. 12 (s, 2H), 5. 3

2 (s, 1H), 6. 04 (d, J=4. 2Hz, 1H), 6. 17 (d, J=4. 4Hz, 1H), 7. 35 (m, 5H).

実施例 9 1 (2 S, 3 S) - 2 - アセトキシ - 3 - {(S) - 2 - (2 10 - クロロベンジロキシカルボニルアミノ) - 4 - メチルバレリルアミノ} テトラヒドロフラン (表 - 2 の化合物番号 5 5 8) の製造融点 1 4 4 - 1 4 7℃ IR (KBr, cm⁻¹): 3 3 1 4, 3 0 7 6, 1 6 9 9, 1 6 5 5,

- 15 NMR (CDC1₃, δ): 0. 92-0. 95 (m, 6H), 1. 5 1-1. 84 (m, 4H), 2. 08 (s, 3H), 2. 34 (m, 1H), 3. 95 (dd, J=8. 8Hz, 7. 4Hz, 1H), 4. 09-4. 16 (m, 2H), 4. 57 (m, 1H), 5. 19 (d, J=13. 0Hz, 1H), 5. 23 (s, 1H), 5. 26 (d, J=13. 0
- 20 Hz, 1H), 6. 16 (d, J=4. 3Hz, 1H), 6. 29 (s, 1H), 7. 25-7. 29 (m, 2H), 7. 37-7. 41 (m, 2H).

実施例 9 2 (2 S、 3 S) - 2 - アセトキシ - 3 - {(S) - 4 - メチルー 2 - (4 - メチルベンジロキシカルボニルアミノ)バレリルアミノ}

25 テトラヒドロフラン (表 - 2 の化合物番号 5 6 6) の製造

融点:161-163℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3314, 1691, 1651, 1539.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 91-0. 93 (m, 6H), 1. 4
6 (m, 4H), 2. 07 (s, 3H), 2. 32 (s, 3H), 2. 3
3 (m, 1H), 3. 94 (q, J=7. 5Hz, 1H), 4. 08-4
. 15 (m, 2H), 4. 57 (m, 1H), 5. 05 (d, J=12.
0Hz, 1H), 5. 06 (s, 1H), 5. 09 (d, J=12. 0H
z, 1H), 6. 15 (d, J=4. 2Hz, 1H), 6. 32 (s, 1H), 7. 15 (d, J=7. 8Hz, 2H), 7. 23 (d, J=7. 8Hz, 2H).

10 実施例93 (2S, 3S) -2-アセトキシ-3-{(S) -2-(9)-フルオレニルメトキシカルボニルアミノ) -4-メチルバレリルアミノテトラヒドロフラン(表-2の化合物番号571)の製造

融点:158-159℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3308, 1746, 1692, 1657, 15 1537.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 94 (m, 6H), 1. 52-1. 7

4 (m, 3H), 1. 64 (m, 1H), 2. 06 (s, 3H), 2. 3 6 (m, 1H), 3. 96 (ddd, J=7. 8Hz, 7. 8Hz, 7. 8Hz, 1H), 4. 11 (m, 2H), 4. 19 (t, J=7. 5Hz 20, 1H), 4. 43 (m, 2H), 4. 56 (m, 1H), 5. 15 (s, 1H), 6. 06 (d, J=4. 2Hz, 1H), 6. 22 (s, 1H), 7. 31 (dd, J=7. 5Hz, 7. 5Hz, 2H), 7. 41 (dd, J=7. 5Hz, 7. 5Hz, 2H), 7. 58 (d, J=7. 5Hz, 2H), 7. 77 (d, J=7. 5Hz, 2H).

25 実施例94 (2S, 3S) - 2 - アセトキシー3 - ((S) - 2 - シクロヘキシルオキシカルボニルアミノー4 - メチルバレリルアミノ)テトラ

ヒドロフラン (表 - 2の化合物番号580) の製造

融点:135-137℃

NMR (CDC1₃, δ): 0. 92-0. 95 (m, 6H), 1. 2 6-1. 88 (m, 14H), 2. 10 (s, 3H), 2. 35 (m, 1 H), 3. 97 (m, 1H), 4. 10-4. 16 (m, 2H), 4. 5 1-4. 64 (m, 2H), 5. 03 (s, 1H), 6. 16 (d, J=4. 5Hz, 1H), 6. 40 (s, 1H).

実施例 95 (2S, 3S) -2- - - -2- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4- -3- -4-

10 フラン (表 - 2 の化合物番号 6 0 5) の製造

融点:182-184℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3308, 1745, 1644, 1551. NMR (CDC1₃, δ): 0. 72 (d, J=6, 4Hz, 3H),

0. 74 (d, J = 6. 4 Hz, 3 H), 1. 10-1. 35 (m, 2 H

15), 1. 47 (m, 1H), 1. 67 (m, 1H), 2. 13 (s, 3H), 2. 20 (m, 1H), 3. 93 (ddd, J=8. 9Hz, 8. 9Hz, 8. 9Hz, 1H), 3. 98-4. 15 (m, 3H), 4. 31

(m, 1H), 4. 46 (m, 1H), 5. 66 (d, J=8.1Hz)

1H), 6. 12 (d, J=4. 6Hz, 1H), 6. 53 (d, J=8

20 . 6 Hz, 1 H), 7. 05-7. 57 (m, 4 H), 7. 80-7. 9 5 (m, 3 H).

実施例96 (2S, 3S) - 2 - アセトキシ-3 - {(S) - 2 - (2 - フルオロベンゾイルアミノ) - 4 - メチルバレリルアミノ} テトラヒドロフラン (表 - 2の化合物番号 6 3 3) の製造

25 融点: 1 6 5 − 1 6 6 °C IR (KBr, cm⁻¹): 3 3 4 3, 3 3 0 4, 1 7 4 8, 1 6 9 4. 1640, 1551.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 96 (d, J=5. 7Hz, 3H), 0. 98 (d, J=5. 7Hz, 3H), 1. 58-1. 95 (m, 4H), 2. 10 (s, 3H), 2. 39 (m, 1H), 3. 95 (ddd,

J=9.0Hz, 9.0Hz, 7.4Hz, 1H), 4.14 (ddd, J=9.0Hz, 9.0Hz, 2.9Hz, 1H), 4.55-4.75 (m, 2H), 6.19 (d, J=4.8Hz, 1H), 6.61 (d,

J=8. 2Hz, 1H), 7. 00 (d, J=7. 4Hz, 0. 5H), 7. 02 (d, J=7. 4Hz, 0. 5H), 7. 15 (dd, J=8.

10 2 Hz, 7. 5 Hz, 1 H), 7. 2 9 (ddd, J=6. 8 Hz, 6. 8 Hz, 0. 9 Hz, 1 H), 7. 5 5 (m, 1 H), 8. 0 6 (ddd , J=7. 9 Hz, 7. 9 Hz, 1. 9 Hz, 1 H).

15 フラン (表 - 2 の化合物番号 6 4 1) の製造

融点:204-205℃

25

IR (KBr, cm⁻¹): 3304, 1746, 1674, 1635. NMR (CDC1₃, δ): 0. 96 (d, J=6, 1Hz, 3H),

0. 97 (d, J=6. 0 Hz, 3 H), 1. 58-1. 78 (m, 3 H 20), 1. 85 (m, 1 H), 2. 13 (s, 3 H), 2. 31 (m, 1 H), 3. 95 (m, 1 H), 4. 14 (ddd, J=8. 6 Hz, 8. 6 Hz, 2. 9 Hz, 1 H), 4. 50-4. 70 (m, 2 H), 6. 20 (d, J=4. 6 Hz, 1 H), 6. 62 (d, J=8. 3 Hz, 1 H) , 6. 81 (d, J=7. 8 Hz, 1 H), 7. 41 (d, J=6. 7 H

実施例 9 8 (2 S, 3 S) – 2 – アセトキシー 3 – { (S) – 4 – メチ

z, 2H), 7, 73 (d, J=6, 7Hz, 2H).

ルー2ー (2ーメチルベンゾイルアミノ) バレリルアミノ) テトラヒドロフラン (表-2の化合物番号645) の製造

融点:185-186℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3264, 1753, 1674, 1626.

5 NMR (CDC1, δ): 0. 99 (d, J=5.6 Hz, 6 H),
1. 55-1. 93 (m, 4H), 2. 11 (s, 3H), 2. 30 (m, 1H), 2. 49 (s, 3H), 3. 98 (m, 1H), 4. 15 (d, d, J=6.3 Hz, 6.3 Hz, 2.9 Hz, 1H), 4. 47-4

70 (m, 2H), 6. 19 (d, J=4.6 Hz, 1H), 6. 28

(d, J=8.2 Hz, 1H), 6. 81 (d, J=8.4 Hz, 1H),
7. 16-7. 29 (m, 2H), 7. 31-7. 40 (m, 2H).

融点:199-200℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3318, 1746, 1663, 1630, 1534.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 96 (d, J=6.0Hz, 3H),

0. 97 (d, J=6.0Hz, 3H), 1. 59-1. 95 (m, 4H),

1, 2. 12 (s, 3H), 2. 29 (m, 1H), 2. 40 (s, 3H),

3. 95 (m, 1H), 4. 13 (ddd, J=6.3Hz, 6.3Hz, 2.9Hz, 1H), 4. 49-4. 70 (m, 2H), 6. 19

(d, J=4.6Hz, 1H), 6.58 (d, J=7.6Hz, 1H)

25 , 6.70 (d, J=7.6Hz, 1H), 7. 24 (d, J=7.8Hz, 2H), 7.69 (d, J=7.8Hz, 2H).

実施例100 (2S, 3S) -2-rセトキシー $3-\{(S)-4-x$ チルー2-(2, 4, 6-トリメチルベンゾイルアミノ) バレリルアミノ テトラヒドロフラン (表-2の化合物番号651) の製造

NMR (CDC1:, δ): 0. 97 (d, J=5. 0Hz, 6H),

- 5 1. 59-1. 79 (m, 3H), 1. 89 (m, 1H), 2. 11 (s
 - , 3H), 2. 27 (s, 6H), 2. 32 (s, 3H), 2. 35 (m
 - 1H, 3. 95 (m, 1H), 4. 14 (ddd, J=9. 0Hz,
 - 9. 0 Hz, 2. 8 Hz, 1 H), 4. 55-4. 70 (m, 2 H), 5
 - . 98 (d, J = 8. 1 Hz, 1 H), 6. 09 (d, J = 4. 6 Hz,
- 10 1 H), 6.84 (s, 2 H), 6.86 (d, J=7.5 Hz, 1 H). 実施例101 (2 S, 3 S) - 3 - ((S) - 4 - メチル-2 - フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ) - 2 - プロピオニルオキシテトラヒドロフラン (表-2の化合物番号720)の製造

融点:154-156℃

- IR (KBr, cm⁻¹): 3355, 3274, 1711, 1678. NMR (CDC1₃, δ): 0. 56 (d, J=6. 3Hz, 3H), 0. 80 (d, J=6. 6Hz, 3H), 1. 17 (t, J=7. 5Hz)
 - , 3H), 1. 39 (m, 2H), 1. 57 (m, 1H), 1. 79 (m
 - , 1 H), 2.23 (m, 1 H), 2.40 (qd, J=7.5 Hz, 1
- 20 6. 8 Hz, 1 H), 2. 4 9 (q d, J=7, 5 Hz, 16, 8 Hz,
 - $1 \, H)$, 3. 62 (m, $1 \, H$), 3. 94 (ddd, J = 9. $0 \, Hz$, 9
 - . $0 \, \text{Hz}$, 9. $0 \, \text{Hz}$, 1 H), 4. 1 3 (ddd, J = 9, $3 \, \text{Hz}$, 9
 - 0 Hz, 3. 0 Hz, 1 H), 4. 92 (d, J = 6. 9 Hz, 1 H)
 - , 6. 17 (d, J = 4. 8 Hz, 1 H), 6. 4 9 (d, J = 8. 7 H
- 25 z, 1 H), 7, 5 3 (m, 2 H), 7, 6 2 (m, 1 H), 7, 8 6 (d, J=6, 0 Hz, 2 H)

実施例102 (2S, 3S) - 3 - ((S) - 4 - メチル-2 - フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ) - 2 - ピバロイルオキシテトラヒドロフラン (表-2の化合物番号725)の製造

融点:165-166℃

- 5 IR (KBr, cm^{-1}): 3293, 1640.
 - NMR (CDC1₃, δ): 0. 64 (d, J=5. 9Hz, 3H),
 - 0. 81 (d, J = 6. 1 Hz. 3 H), 1. 26 (s, 9 H), 1. 4
 - 8 (m, 3H), 1.72 (m, 1H), 2.23 (m, 1H), 3.6
 - 4 (m, 1H), 3. 94 (ddd, J=9. 1Hz, 9. 1Hz, 9.
- 10 1 Hz, 1H), 4.10 (ddd, J=9.1Hz, 9.1Hz, 3.
 - 1 Hz, 1 H), 4.45 (m, 1 H), 5.07 (d, J=7.7 Hz
 - , 1 H), 6. 10 (d, J=4.5 Hz, 1 H), <math>6. 21 (d, J=
 - 8. 4 Hz, 1 H), 7. 5 1 (m, 2 H), 7. 6 1 (m, 1 H), 7
 - .86 (d, J=7.1Hz, 2H).
 - 15 実施例103 (2S, 3S) 2-ベンゾイルオキシー3-((S) 4-メチル-2-フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ)テトラヒドロフラン(表-2の化合物番号728)の製造

融点:184-185℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3353, 3260, 1698, 1678.

- 20 NMR (CDC1₃, δ): 0. 55 (d, J=6. 0 Hz, 3 H),
 - 0. 69 (d, J = 6. 0 Hz, 3 H), 1. 3 0 1. 4 8 (m, 3 H
 -), 1. 90 (m, 1H), 2. 30 (m, 1H), 3. 64 (m, 1H
 -), 4. 00 (ddd, J=9. 3 Hz, 9. 0 Hz, 7. 5 Hz, 1 H
 -), 4. 19 (ddd, J=9. 3Hz, 9. 3Hz, 3. 0Hz, 1H
- 25), 4. 51 (m, 1H), 5. 13 (d, J=8. 1Hz, 1H), 6 37 (d, J=6. 6Hz, 1H), 6. 39 (d, J=4. 2Hz,

1 H), 7. 26-7. 50 (m, 4 H), 7. 58 (m, 2 H), 7. 80 (dd, J=7. 5 Hz, 1. 8 Hz, 2 H), 8. 06 (dd, J=7. 8 Hz, 0. 9 Hz, 2 H).

実施例104 (2S, 3S) - 2 - アセトキシ-3 - {(S) - 2 - (
 4 - クロロフェニルスルホニルアミノ) - 4 - メチルバレリルアミノ} テトラヒドロフラン (表-2の化合物番号754) の製造

融点:136-137℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3335, 3258, 1744, 1651, 1535.

10 NMR (CDC1₃, δ): 0. 61 (d, J=6. 2Hz, 3H),
0. 83 (d, J=6. 3Hz, 3H), 1. 35-1. 62 (m, 3H),
1. 80 (m, 1H), 2. 15 (s, 3H), 2. 21 (m, 1H),
3. 61 (m, 1H), 3. 97 (ddd, J=9. 1Hz, 9. 1Hz, 9. 1Hz, 9. 1Hz, 1H), 4. 14 (ddd, J=9. 1Hz, 9. 1Hz, 9. 1Hz, 1H), 4. 50 (m, 1H), 5. 09 (d, J=7. 3Hz, 1H), 6. 15 (d, J=4. 6Hz, 1H), 6. 42 (d, J=8. 8Hz, 1H), 7. 51 (d, J=8. 6Hz, 2H),
7. 80 (d, J=8. 6Hz, 2H).

融点:155-156℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3366, 3229, 1726, 1684, 1664, 1543.

25 NMR (CDC1₃, δ): 0. 70 (d, J=6. 3Hz, 3H), 0. 83 (d, J=6. 4Hz, 3H), 1. 25 (s, 9H), 1. 4 0-1. 82 (m, 4H), 2. 23 (m, 1H), 3. 62 (dd, J =12. 5Hz, 6. 4Hz, 1H), 3. 96 (ddd, J=8. 9H z, 8. 9Hz, 8. 9Hz, 1H), 4. 11 (ddd, J=8. 9H z, 8. 9Hz, 2. 9Hz, 1H), 4. 45 (m, 1H), 5. 21 (d, J=8. 2Hz, 1H), 6. 04 (d, J=8. 6Hz, 1H) , 6. 10 (d, J=4. 5Hz, 1H), 7. 45-7. 55 (m, 2 H), 7. 75-7. 85 (m, 2H).

実施例106 (2S, 3S) -2-アセトキシ-3-{(S)-4-メ チル-2-(4-メチルフェニルスルホニルアミノ) バレリルアミノ} テ 10 トラヒドロフラン (表-2の化合物番号761) の製造

融点:159-160℃

IR (KBr, cm^{-1}): 3372, 1721, 1674, 1535. NMR (CDC1₃, δ): 0. 52 (d, J=6, 2Hz, 3H).

- 0. 80 (d, J=6. 3Hz, 3H), 1. 36 (m, 2H), 1. 5
- 15 6 (m, 1 H), 1. 8 3 (m, 1 H), 2. 1 6 (s, 3 H), 2. 2
 - 2 (m, 1 H), 2. 4 4 (s, 3 H), 3. 5 9 (m, 1 H), 3. 9
 - 4 (m, 1H), 4.14 (m, 1H), 4.56 (m, 1H), 4.8
 - 1 (d, J = 6. 6 H z, 1 H), 6. 1 5 (d, J = 4. 6 H z, 1 H
 -), 6. 35 (d, J=7. 8Hz, 1H), 7. 33 (d, J=8. 0
- 20 Hz, 2H), 7. 74 (d, J = 8. 0Hz, 2H).

実施例107 (2S, 3S) $-2-7セトキシ-3-\{(S)-4-メチル-2-(2, 4, 6-トリメチルフェニルスルホニルアミノ) バレリルアミノ} テトラヒドロフラン (表<math>-2$ の化合物番号765) の製造

融点:158-159℃

25 IR (KBr, cm⁻¹): 3416, 3191, 1755, 1661, 1605, 1535.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 56 (d, J=6. 3Hz, 3H), 0. 79 (d, J=6. 3Hz, 3H), 1. 39 (m, 2H), 1. 58 (m, 1H), 1. 81 (m, 1H), 2. 16 (s, 3H), 2. 24 (m, 1H), 2. 31 (s, 3H), 2. 62 (s, 6H), 3. 56 (m, 1H), 3. 94 (m, 1H), 4. 14 (m, 1H), 4. 52 (m, 1H), 5. 00 (d, J=7. 1Hz, 1H), 6. 15 (d, J=4. 6Hz, 1H), 6. 61 (d, J=8. 7Hz, 1H), 6

実施例108 (2S, 3S) - 2-アセチル-3- {(S) - 2-(4) 10 ーtertープチルフェニルスルホニルアミノ) - 4-メチルバレリルアミノ} テトラヒドロフラン (表-2の化合物番号768) の製造 NMR (CDC13, 6): 0.44(d, J=6.2Hz, 3H), 0.77(d, J=6.2Hz, 3H), 1.23-1.43(m, 2H), 1.34(s, 9H), 1.55(m, 1H), 1.85(m, 1H)), 2.17(s, 3H), 2.20(m, 1H), 3.59(m, 1H)), 3.95(m, 1H), 4.13(ddd, J=9.0Hz, 9.0Hz, 2.9Hz, 1H), 4.57(m, 1H), 4.95(d, J=

6. 4 Hz, 1 H), 6. 1 7 (d, J=4. 6 Hz, 1 H), 6. 7 7 (d, J=8. 7 Hz, 1 H), 7. 5 3 (d, J=8. 6 Hz, 2 H)

20 , 7. 7 8 (d, J=8. 6 Hz, 2 H).

実施例109 (2S, 3S) $-2-rセチル-3-\{(S)-2-(4-x)$ トラヒドロフラン (3S) $-2-rセチル-3-\{(S)-2-(4-x)$ トラヒドロフラン (3S) (3S) $-2-rセチル-3-\{(S)-2-(4-x)\}$ (3S) -2-re

融点:157-158℃

. 97 (s, 2H).

25 IR (KBr, cm⁻¹): 3329, 3273, 1746, 1659, 1597, 1544, 1501.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 54 (d, J=6. 1 Hz, 3 H),

0. 81 (d, J = 6. 3 Hz, 3 H), 1. 38 (m, 2 H), 1. 5

6 (m, 1H), 1.84 (m, 1H), 2.16 (s, 3H), 2.2

2 (m, 1H), 3.56 (m, 1H), 3.88 (s, 3H), 3.9

5 5 (m, 1H), 4, 15 (m, 1H), 4, 56 (m, 1H), 4, 8

1 (d, J=6. 4 Hz, 1 H), 6. 16 (d, J=4. 5 Hz, 1 H

), 6. 68 (d, J=9. 2 Hz, 1 H), 6. 99 (d, J=8. 6

Hz, 2H), 7. 79 (d, J=8. 6Hz, 2H).

実施例110 (25, 35) -2-アセトキシー3- ((S) -4-メ

10 チルー2-(2-ナフチルスルホニルアミノ) バレリルアミノ テトラヒ

ドロフラン (表 - 2 の化合物番号 7 8 0) の製造

融点:158-159℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3337, 3275, 1723, 1676,

1543.

15 NMR (CDC1₃, δ): 0. 48 (d. J=6. 1 Hz. 3 H),

0. 76 (d, J = 6. 2 Hz, 3 H), 1. 33-1. 75 (m, 4 H

), 1. 97 (m, 1H), 2. 15 (s, 3H), 3. 68 (m, 1H

), 3. 87 (m, 1H), 4. 05 (m, 1H), 4. 42 (m, 1H

), 5. 19 (d, J = 7. 1 Hz, 1 H), 6. 12 (d, J = 4. 6

20 Hz, 1H), 6. 53 (d, J = 8. 7Hz, 1H), 7. 58-7.

71 (m, 2 H), 7.82 (dd, J=8.7 Hz, 1.9 Hz, 1 H

), 7. 87-8. 03 (m, 3H), 8. 44 (s, 1H).

実施例111 (25, 35) -2-アセトキシ-3-{(S)-4-メ

チルー2-(3-ピリジルスルホニルアミノ) バレリルアミノ>テトラヒ

25 ドロフラン (表 - 2 の化合物番号 7 8 2) の製造

融点:160-161℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3410, 3075, 1753, 1657, 1535, 1342, 1172.

NMR (CDC1₂, δ): 0. 68 (d, J=5, 9Hz, 3H). 0. 85 (d, J=5. 9Hz, 3H), 1. 40-1. 62 (m, 3H), 1. 80 (m, 1H), 2. 14 (s, 3H), 2. 22 (m, 1H 5), 3. 73 (m, 1H), 3. 96 (ddd, J=9. 1Hz, 8. 9Hz, 8. 9Hz, 1H), 4. 03 (ddd, J=9. 1Hz, 9. 1 Hz, 3.0Hz, 1H), 4.45 (m, 1H), 5.46 (m, 1H), 6. 13 (d, J=4. 6 Hz, 1 H), 6. 32 (d, J=8. 6 10 Hz, 1H), 7, 48 (m, 1H), 8, 16 (ddd, J=8, 2H z, 1. 9Hz, 1. 9Hz, 1H), 8. 83 (dd, J=4. 9Hz1.5Hz, 1H), 9.07 (d, J=2.3Hz, 1H). $(2S, 3S) - 2 - 7t + 5 - 3 - \{(S) - 2 - (S) - (S) - 2 - (S) - ($ 実施例112 チルバレリルアミノ}テトラヒドロフラン(表-2の化合物番号1065 15

融点:154℃

)の製造

IR (KBr, cm⁻¹): 3387, 1746, 1674, 1522.

NMR (CDC1₃, δ): 0.84 (d, J=6.3Hz, 3H),

0.93 (d, J=6.3Hz, 3H), 1.58 (m, 2H), 1.8

4 (m, 1H), 2.09 (m, 1H), 2.12 (s, 3H), 2.3

3 (s, 3H), 2.38 (m, 1H), 2.47 (s, 3H), 3.9

6 (m, 1H), 4.14 (m, 1H), 4.55 (m, 1H), 4.7

8 (t, J=6.8Hz, 1H), 6.14 (d, J=4.6Hz, 1H

25), 6.50 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.39 (d, J=8.1

Hz, 2H), 7.91 (d, J=8.1Hz, 2H).

実施例113 (2S, 3S) -2-7セトキシ-3- ((S) -2-(N-7セチル-N-(4-4-メトキシフェニルスルホニル) アミノ) -4-メチルバレリルアミノ} テトラヒドロフラン (表-2の化合物番号1066) の製造

- 5 融点:64-66℃
- IR (KBr, cm⁻¹): 3397, 1748, 1595, 1530.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 85 (d, J=6. 2Hz, 3H),

- 0. 94 (d, J = 6. 3 Hz, 3 H), 1. 5 9 (m, 2 H), 1. 8
- 5 (m, 1H), 2. 08 (m, 1H), 2. 12 (s, 3H), 2. 3
- 10 2 (s, 1 H), 2. 37 (m, 1 H), 3. 90 (s, 3 H), 3. 9
 - 6 (m, 1H), 4. 15 (m, 1H), 4. 56 (m, 1H), 4. 7
 - 9 (t, J=6. 8 Hz, 1 H), 6. 15 (d, J=4. 7 Hz, 1 H
 -), 6. 51 (d, J=8. 4 Hz, 1 H), 7. 04 (d, J=9. 0

Hz, 2H), 7. 97 (d, J=9. 0Hz, 2H).

実施例114 (2S, 3S) - 2-アセトキシ-3-((S) - 2-ベンジロキシカルボニルアミノ-4-メチルバレリルアミノ) - 2-テトラヒドロフラン(表-2の化合物番号983)の製造

IR (KBr, cm⁻¹): 3310, 1693, 1653, 1537.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 90-0. 93 (m, 6H), 1. 4

3-1.77 (m, 7H), 2.11 (s, 3H), 3.65-3.74

(m, 2H), 4. 08-4. 17 (m, 2H), 5. 09 (s, 2H)

, 5. 30 (d, J = 8. 1 Hz, 1 H), 5. 96 (d, J = 2. 7 H

z, 1H), 6. 17 (s, 1H), 7. 34 (m, 5H).

実施例115 (2S,3S)-2-アセトキシ-3- {(S)-2-(

25 2-フルオロベンゾイルアミノ) - 4-メチルバレリルアミノ} - 2-テトラヒドロピラン (表-2の化合物番号1000) の製造

IR (KBr, cm⁻¹): 3298, 2947, 1633, 1545.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 91-0. 98 (m, 6H), 1. 6
5-1. 77 (m, 7H), 2. 13 (s, 3H), 3. 64-3. 77

(m, 2H), 3. 90 (m, 1H), 4. 20 (m, 1H), 4. 60

5 (s, 1H), 6. 00 (d, J=3. 3Hz, 1H), 6. 42 (s, 1H), 7. 13 (m, 1H), 7. 26 (m, 1H), 7. 48 (m, 1H), 8. 02 (m, 1H).

実施例116 (2S, 3S) -2-rセトキシ $-3-\{(S)-4-x$ チル-2-(2, 4, 6-トリメチルフェニルスルホニルアミノ) バレリルアミノ} -2-テトラヒドロピラン(表-2の化合物番号1023) の製造

IR (KBr, cm⁻¹): 3418, 1658, 1606, 1523.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 57 (d, J=6. 3Hz, 3H),

0. 79 (d, J=6. 3Hz, 3H), 1. 32-1. 78 (m, 7H)

15), 2. 16 (s, 3H), 2. 29 (s, 3H), 2. 60 (s, 6H)

), 3. 49 (m, 1H), 3. 61-3. 78 (m, 2H), 4. 08

(m, 1H), 5. 08 (d, J=7. 2Hz, 1H), 5. 94 (d, J=3. 0Hz, 1H), 6. 33 (d, J=8. 7Hz, 1H), 6.

95 (s, 2H).

20 実施例117 (2S, 3S)-3-{(S)-2-(4-tert-ブ チルフェニルスルホニルアミノ)-4-メチルバレリルアミノ}-2-ピ バロイルオキシテトラヒドロフラン(表-2の化合物番号1397)の製 造

融点:166-167℃

25 IR (KBr, cm⁻¹): 3360, 1728, 1682, 1665, 1547.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 55 (d, J=6.0Hz, 3H), 0. 78 (d, J=6.0Hz, 3H), 1. 25 (s, 9H), 1. 3

2 (s, 9H), 1. 38-1. 82 (m, 4H), 2. 25 (m, 1H

), 3. 60 (m, 1H), 3. 95 (m, 1H), 4. 12 (ddd,

J = 9.0 Hz, 9.0 Hz, 3.0 Hz, 1 H), 4.46 (m.1 H)

), 5. 05 (d, J=7. 1 Hz, 1 H), 6. 10 (d, J=4. 5

Hz, 1H), 6.41 (d, J=8.3Hz, 1H), 7.52 (d.

J = 8. 6 H z, 2 H), 7. 7 8 (d, J = 8.6 H z, 2 H).

実施例118 (3S) -2-メトキシ-3-((S) -4-メチル-2

10 -フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ)テトラヒドロフラン(表-

2の化合物番号741)の製造

実施例88で得られた(25.35)-2-アセトキシー3-((S)

- 4 - メチル- 2 - フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ) テトラヒ

ドロフラン43mgをメタノール40mlに溶かし、4規定の塩化水素含

15 有酢酸エチル1m1を加えた。室温で一晩撹拌した後、飽和重曹水7m1

を加え、溶媒を留去した。残渣に飽和重曹水を加え、酢酸エチルで抽出し

た。抽出液を飽和食塩水で洗浄し、硫酸マグネシウムで乾燥した。乾燥剤

を濾過してから濾液を濃縮し、得られた租生成物にヘキサンおよびジエチ

ルエーテルを加えて撹拌した後、濾過すると目的物2gmgが得られた。

20 収率:65%

融点:84-90℃

IR (KBr, cm⁻¹): 3268, 1647, 1618.

NMR (CDC1₃, δ): 0. 71 (d, J=6.6 Hz, 2.1 H

), 0. 80 (d, J=6. $6\,H\,z$, 0. $9\,H$), 0. 84 (d, J=6

25 . $6 \,\mathrm{Hz}$, 2. $1 \,\mathrm{H}$), 0. $8 \,8$ (d, J = 6. $6 \,\mathrm{Hz}$, 0. $9 \,\mathrm{H}$), 1

. 42-1. 49 (m, 3H), 1. 61 (m, 1H), 2. 08 (m,

0. 3 H), 2. 2 7 (m, 0. 7 H), 3. 3 0 (s, 2. 1 H), 3
. 3 7 (s, 0. 9 H), 3. 6 3 (m, 1 H), 3. 6 9 (m, 0. 3 H), 3. 8 1 - 4. 1 1 (m, 1. 7 H), 4. 1 3 (m, 1 H), 4
. 6 6 (s, 0. 7 H), 4. 7 1 (d, J = 4. 8 Hz, 0. 3 H),
4. 6 6 (d, J = 7. 8 Hz, 0. 7 H), 5. 2 3 (d, J = 8. 4 Hz, 0. 3 H), 5. 9 6 (d, J = 7. 8 Hz, 0. 7 H), 6. 1
7 (d, J = 8. 7 Hz, 0. 3 H), 7. 4 7 - 7. 6 2 (m, 3 H), 7. 8 6 (d, J = 7. 5 Hz, 2 H).

試験例1 システインプロテアーゼ阻害活性の測定

10 カテプシンB (シグマ社、C-6286) の阻害活性は、文献 (Bio chemical Journal, 201巻、189ページ、1982年) 記載の方法に準じて測定した。その結果を表-5に示す。

m-カルパインは、ラットの脳より文献(Journal of Biological Chemistry, 259巻、3210ページ、1 984年)記載の方法により精製し、その阻害活性は、文献(Journal of Biological Chemistry, 259巻、12489ページ、1984年)記載の方法に準じて測定した。その結果を表-6に示す。

表 - 5 および表 - 6 より、本発明の化合物は、パパイン、カテプシンB、 20 カテプシンL、カルパイン等のシステインプロテアーゼに対して、強い阻 害活性を示すことがわかる。

3 8 6

表-5 カテプシンBの阻害活性

実施例番号の化合物	I C 50	実施例番号の化合物	I C 50
(表-1の化合物番号)	(μM)	(表-1の化合物番号)	(μM)
1 (196)	0.42	40 (113)	1.00
4 (20)	0.70	41 (114)	0.87
5 (21)	0. 98	42 (115)	0. 55
6 (22)	1. 35	43 (121)	0.14
7 (23)	0.90	44 (125)	1. 45
1.00.0(27)	0.37	45 (126)	0. 49
11 (28)	2. 15	46 (127)	0. 27
12(29)	1.20	48 (130)	0. 086
13 (31)	0.38	50 (134)	0. 20
15 (37)	0.70	51 (137)	0.21
16 (38)	1.00	53 (140)	0.15
17 (40)	0.64	55 (142)	1.65
18 (44)	0.58	56 (144)	0.90
19 (46)	0.89	57 (148)	0. 24
20 (47)	1.05	58 (152)	0.46
21 (49)	1.17	59 (156)	0.80
24 (53)	2. 90	60 (157)	0.034
25 (54)	2. 90	61 (161)	1.20
27 (60)	1.20	62 (170)	0.50
28 (61)	1.70	65 (187)	0.19
3 3 (8 5)	0. 95	75 (229)	2. 40
34 (90)	1.35	77 (232)	0.40
3 9 (1 1 2)	0.20	78 (246)	0.30
実施例番号の化合物	I C 80		
(表-3の化合物番号)	(µ M)		
87 (1126)	1.30		

Same and the second of the

3 8 7

表-6 カルパインの阻害活性

20 777770円合わけ						
実施例番号の化合物	I C 50	実施例番号の化合物 ICs。				
(表-1の化合物番号)	(µ M)	(表-1の化合物番号)	(µ M)			
1 (196)	0. 62	27 (60)	0. 65			
4 (20)	0.90	28 (61)	0. 52			
5 (21)	2. 30	3 3 (8 5)	0.11			
6 (22)	2. 30	34 (90)	0.33			
7 (23)	2. 40	39 (112)	0.37			
9 (25)	1.55	40 (113)	0.17			
10 (27)	0. 96	41 (114)	1. 15			
11 (28)	1.10	42 (115)	0.82			
12 (29)	0. 65	43 (121)	0.36			
13 (31)	0. 66	44 (125)	0. 58			
15 (37)	0. 68	45 (126)	0. 56			
16 (38)	0. 34	46 (127)	0. 33			
17 (40)	0. 39	47 (129)	2. 30			
18 (44)	0.44	48 (130)	0. 38			
19 (46)	0. 48	49 (131)	0. 68			
20 (47)	0.56	50 (134)	0.65			
21 (49)	0. 34	51 (137)	0. 48			
22 (51)	0.41	5 2 (1 3 8)	0.34			
23 (52)	1.10	53 (140)	0.67			
24 (53)	1. 30	54 (141)	0.70			
25 (54)	1.05	55 (142)	0.84			
26 (57)	1. 40	56 (144)	0. 64			

3 8 8

表-6 (つづき)

実施例番号の化合物	I C 50
(表-1の化合物番号)	(μM)
57 (148)	0. 25
58 (152)	0.44
5 9 (1 5 6)	0.40
60 (157)	0.47
61 (161)	0. 35
62 (170)	1.00
63 (175)	0.35
65 (187)	0.70
66 (202)	0.60
68 (205)	0.56
69 (208)	0. 62
70 (211)	0.50
71 (215)	0. 45
72 (218)	0. 39
73 (221)	0.74
74 (227)	0. 95
75 (229)	0. 38
76 (230)	0.36
77 (232)	1.00
80 (320)	2.80
81 (468)	1.55
実施例番号の化合物	I C 50
(表-3の化合物番号)	(μM)
87 (1126)	0. 78

試験例2 血液中での活性本体の生成

実施例88で得られた(25,35)-2-アセトキシー3-((S) - 4 - メチル- 2 - フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ) テト ラヒドロフランをアセトニトリルに溶かし、最終濃度が100μMにな るようにラットの血清に添加した。37℃で5分間インキュベーション 5 した後、アセトニトリルを加え、遠心分離して得られた溶液部分をHP LCで測定した。その結果を第1図に示す。また、対比のため、実施例 1で得られた(3S) - 3 - ((S) - 4 - xチルー2 - 7ェニルスル ホニルアミノバレリルアミノ) -2-テトラヒドロフラノールおよび実 施例88で得られた(2S, 3S)-2-アセトキシ-3-((S)-10 4-メチル-2-フェニルスルホニルアミノバレリルアミノ)テトラヒ ドロフランをアセトニトリルに溶かしたものをHPLCで測定した。そ の結果を第2図に示す。第1図および第2図より、加えた(2S, 3S ニルアミノバレリルアミノ)テトラヒドロフランの97%が加水分解さ 15 れ、活性本体である(3S)-3-((S)-4-メチル-2-フェニ ルスルホニルアミノバレリルアミノ) -2-テトラヒドロフラノール(実施例1の化合物)に変換されていることが判明した。ヒトおよびイヌ の血漬でも同様の操作を行ない、活性本体が生成することを確認した。

20 HPLCの条件は以下の通り。

カラム Nucleosil 100 s C₁₈ 4.6×250mm (ナーゲル社製)

カラム温度 50℃

25

移動相 CH₂ CN: H₂ O: PIC A Low UV (Waters社製)

22:78:1

流速 1ml/min

検出波長 UV222nm

この結果より、本発明の含酸素複素環誘導体は、生体内ですみやかに活性本体であるラクトール誘導体に変換されることがわかる。

試験例3 急性毒性試験

5 SD雌雄ラットに本発明の化合物を 0.5% CMC-Na水溶液に懸 濁させたものを強制経口投与し、7日間症状観察を行った。

実施例88、96、106の化合物のLDso値は、いずれも>200 0mg/kgであった。

試験例4 製剤例

10 (1)錠剤

下記の成分を常法に従って混合し、慣用の装置により打錠した。

実施例88の化合物

30 mg

結晶セルロース

60 mg

コーンスターチ

100mg

15 乳 糖

200mg

ステアリン酸マグネシウム

4 mg

(2) 軟カプセル剤

下記の成分を常法に従って混合し、軟カプセルに充填した。

実施例88の化合物

30 mg

20 オリーブ油

3 0 0 mg

レシチン

2 0 m g

(3) 注射用製剤

下記の成分を常法に従って混合し、1mlのアンブルを調整した。

実施例25の化合物

 $-3 \,\mathrm{mg}$

25 塩化ナトリウム

4 mg

注射用蒸留水

1 m 1

10

産業上の利用可能性

本発明の含酸素複素環誘導体は、パパイン、カテブシンB、カテブシンH、カテプシンL、カルパイン、インターロイキン1 β変換酵素等のシステインプロテアーゼに対して強い阻害作用を示し、また経口吸収性、組織移行性、細胞膜透過性にもすぐれていることから、筋ジストロフィー、筋萎縮症、心筋梗塞、脳卒中、アルツハイマー病、頭部外傷等の意識障害や運動障害、多発性硬化症、末梢神経のニューロパシー、白内障、炎症、アレルギー、劇症肝炎、骨粗鬆症、高カルシウム血症、乳癌、前立腺癌、前立腺肥大等の治療薬として、あるいは癌の増殖抑制、転移予防薬、血小板の凝集阻害薬として用いることができる。

20

25

3 9 2

請求の範囲

1. 下記一般式(I)

$$R^{s}-N-C-$$
または $R^{s}-S-(R^{s}$ は $C_{s}\sim C_{s}$ のシクロアルキル基、 H

 $C_3 \sim C_8$ のシクロアルキルオキシ基、フルオレニル基、 $C_1 \sim C_5$ のアルコキシ基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリールオキシ基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリールチオ基、置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリールスルホニル基および置換基を有していてもよい $Q_8 = Q_8

15

20

25

シ基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₁~C₂。 のアルキル基;または置換基を有していてもよいC₅~C₁,のアリール基

を表し、 R^7 は水素原子、 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基または $R^9 - C_-$ (R^9 は $C_1 \sim C_{10}$ のアルキル基または置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{12}$ のアリール基を表す)を表し、Aは $C_1 \sim C_3$ のアルキル基を有していてもよい $C_1 \sim C_3$ のアルキレン基を表し、 $R^9 - C_-$ で表される含酸素複素環誘導体、その塩、その溶媒和物またはその水和物。

3. R^2 、 R^4 および R^6 がそれぞれ独立して水素原子または $C_1 \sim C_3$

- のアルキル基である請求項2記載の化合物。
 - 4. nが0である請求項3記載の化合物。
- 5. R¹ がR° -C-(R° は置換基を有していてもよいC。~C14の アリール基、置換基を有していてもよいC。~C14のアリールオキシ基、 置換基を有していてもよいC。~C14のアリールチオ基および置換基を有 していてもよいC。~C14のアリールスルホニル基からなる群より選ばれ る1以上の置換基を有していてもよいC1~C20のアルキル基;置換基を 有していてもよいC6~C14のアリール基;置換基を有していてもよいC。 10 ~C14のアリール基で置換されていてもよいC2~C5のアルケニル基; または置換基を有していてもよい複素環残基を表す)であり、R²、R⁴ およびR°が水素原子であり、R³ およびR⁵ がそれぞれ独立してC1~
- C_{20} のアルキル基であり、 R^7 が水素原子または $R^9 C (R^9 は C_1 C_{10}$ 00アルキル基を表す)であり、Aが $C_1 \sim C_3$ 00アルキレン基であり、 R^7 0である請求項1記載の化合物。
 - 6. R⁷ が水素原子である請求項5記載の化合物。
- 7. R⁷ がR⁹ C (R⁹ は炭素数 1 ~ 1 0 のアルキル基を表す)で 20 ある請求項 5 記載の化合物。

5

 $9. R^1 がR^8 - O - C - (R^8 はC_3 \sim C_3 のシクロアルキル基、フルオレニル基、置換基を有していてもよい<math>C_6 \sim C_{14}$ のアリール基および置換基を有していてもよい複素環残基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基: $C_3 \sim C_6 のシクロアルキル基:または置換基を有していてもよい<math>C_6 \sim C_{14}$ のアリール基を表す)であり、 R^2 、 R^4 および R^6 が水素原子であり、 R^3 および R^5 がそれぞれ独立して水素原子;または置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基および $C_1 \sim C_5 のアルコキシ基からなる群より選ばれる <math>1$ 以上の置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基であり、 R^7 が

15

- 水素原子または R° -C $-(R^{\circ}$ は C_{10} のアルキル基を表す)であり、A が C_{1} \sim C_{3} のアルキレン基であり、n が 0 である請求項 1 記載の化合物。
 - 10. R⁷ が水素原子である請求項9記載の化合物。

20

□ 1 1 . R⁷ がR⁹ - C - (R⁹ はC₁ ~ C₁₀のアルキル基を表す)である請求項 9 記載の化合物。

25

12. R^1 が R^8 $-O-C-(R^8$ はフルオレニル基および置換基を有していてもよい C_8 $\sim C_{14}$ のアリール基からなる群より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい C_1 $\sim C_{20}$ のアルキル基:または C_8 $\sim C_8$ の

シクロアルキル基を表す)であり、 R^2 、 R^4 および R^6 が水素原子であり、 R^3 および R^6 がそれぞれ独立して $C_1 \sim C_{20}$ のアルキル基であり、

U || | R⁷ がR⁹ − C − (R⁹ はC₁ ∼ C₁₀のアルキル基を表す)であり、Aが | C₁ ∼ C₃ のアルキレン基であり、nが0である請求項1記載の化合物。

O || 13. R' がR* -N-C-(R*は置換基を有していてもよいC。~ H

 C_{14} のアリール基を表す)であり、 R^2 、 R^4 および R^6 が水素原子であ り、 R^3 および R^6 がそれぞれ独立して C_1 ~ C_{20} のアルキル基であり、

O || 15. R¹ がR* - S - (R* は置換基を有していてもよいC。~C」4 || O

のアリール基または置換基を有していてもよい複素環残基を表す)であり、 R²、R⁴ およびR⁵ が水素原子であり、R² およびR⁵ がそれぞれ独立 して $C_1 \sim C_2$ のアルキル基であり、R⁷ が水素原子、 $C_1 \sim C_5$ のアル

ー キル基またはR°-C-(R°はC, ~C₁₀のアルキル基または置換基を有していてもよいC。~C₁₂のアリール基を表す)であり、AがC, ~C₃のアルキル基を有していてもよいC, ~C₃のアルキレン基であり、nが0である請求項1記載の化合物。

16. R⁷ が水素原子である請求項15記載の化合物。

17. R⁷ がC₁ ~ C₂ のアルキル基である請求項15記載の化合物。

のアリール基を表す)であり、 R^7 が $C_1 \sim C_3$ のアルキル基である請求項 1.5 記載の化合物。

O || 19. R⁷ がR⁸ - C - (R⁸ はC₁ ~ C₁₀のアルキル基を表す)であ 10 る請求項15記載の化合物。

□ 20. R⁷ がR⁹ - C - (R⁹ は置換基を有していてもよいC₆ ~ C₁₂ のアリール基を表す)である請求項15記載の化合物。

O || 15 21. R¹ がR* - S - (R*は置換基を有していてもよいC。~C,4 || O

OFリール基を表す)であり、R⁷がR⁸-C-(R⁸は置換基を有してしてもよいC₆~C₁₂のアリール基を表す)である請求項15記載の化合20 物。

22.
$$R^{1} N^{2} - C - R^{3} - O - C - R^{3} - S - (R^{3} L (1))$$

 $C_1 \sim C_3$ のアルキル基、ハロゲン原子および $C_1 \sim C_3$ のアルコキシ基 25 からなる群より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ の アリール基: $C_3 \sim C_3$ のシクロアルキル基: または $C_1 \sim C_3$ のアルキ

10

ル基から選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい複素環残基により置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基 (2) $C_3 \sim C_6$ のシクロアルキル基 (3) $C_1 \sim C_3$ のアルキル基、ハロゲン原子、ニトロ基、フルオレニル基および $C_1 \sim C_3$ のアルコキシ基からなる群より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{11}$ のアリール基 (4) $C_1 \sim C_3$ のアルキル基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{11}$ のアリール基により置換されていてもよい $C_2 \sim C_3$ のアルケニル基、または (5) $C_1 \sim C_3$ のアルキル基およびハロゲン原子からなる群より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい $C_1 \sim C_3$ のアルキル基および $C_1 \sim C_3$ のアルキル基および $C_1 \sim C_3$ のアルキル基であり、 $C_1 \sim C_3$ のアルキル基であり、 $C_1 \sim C_4$ のアリール基で置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基であり、 $C_1 \sim C_4$ のアリール基で置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基であり、 $C_1 \sim C_4$ が $C_1 \sim C_5$ のアルキル基であり、 $C_1 \sim C_5$ のアルキル基であり、 $C_1 \sim C_5$ のアルキル基であり、 $C_1 \sim C_5$ のアリール基で置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基であり、 $C_1 \sim C_5$ が $C_2 \sim C_{11}$ のアリール基で置換されていてもよい $C_1 \sim C_6$ のアルキル基であり、 $C_1 \sim C_5$ が $C_2 \sim C_5$ が $C_3 \sim C_5$ が $C_4 \sim C_5$ が $C_5 \sim C_5$ のアルキル基であり、 $C_1 \sim C_5$ のアルキル

○ || 15 R°-C-(R°はC₁~C。のアルキル基を表す)である請求項1記載の化合物。

23.
$$R^{1} \approx R^{8} - C - R^{8} - O - C - R^{8} - S - (R^{8} \text{ if } (1))$$

20 C₁~C₃のアルキル基、ハロゲン原子およびC₁~C₃のアルコキシ基からなる群より選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC₆~C₁₁のアリール基; C₃~C₆のシクロアルキル基; ピリジル基; C₁~C₃のアルキル基から選ばれる1以上の置換基を有していてもよいイミダゾール基; フリル基; テトラヒドロフリル基; またはテトラヒドロピラニル基により置換されていてもよいC₁~C₆のアルキル基 (2) C₃~C₈のシクロアルキル基 (3) C₁~C₃のアルキル基、ハロゲン原子、ニト

口基、フルオレニル基および $C_1 \sim C_3$ のアルコキシ基からなる群より選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基 (4) $C_1 \sim C_3$ のアルキル基により置換されていてもよい $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基により置換された $C_2 \sim C_3$ のアルケニル基 (5) ピリジル基 (6) $C_1 \sim C_3$ のアルキル基から選ばれる 1 以上の置換基を有していてもよいイミダゾール基 (7) クロマニル基 (8) フリル基 (9) テトラヒドロフリル基または (10) テトラヒドロピラニル基を表す) であり、 R^2 、 R^4 および R^6 が水素原子であり、 R^3 が $C_1 \sim C_6$ のアルキル基であり、 R^5 が $C_6 \sim C_{14}$ のアリール基で置換されていてもよい $C_1 \sim$

10

5

C。のアルキル基であり、R が水素原子またはR $^{\circ}$ -C $^{\circ}$ (R はC $^{\circ}$ $^{$

 $24. AがC_1 \sim C_3$ のアルキル基を有していてもよいエチレン基であり、n が 0 である請求項 23 記載の化合物。

15

20

C。のアルキル基で置換されていてもよいC。 $\sim C$ 14のアリール基で置換されていてもよいC1 $\sim C$ 3 のアルキル基;またはC1 $\sim C$ 3 のアルキル基から選ばれる1以上の置換基を有していてもよいC5 $\sim C$ 14のアリール基を表す)であり、R2 、R4 およびR5 が水素原子であり、R3 および

 $R^{\mathfrak{s}}$ が $C_{1} \sim C_{\mathfrak{s}}$ のアルキル基であり、 R^{7} が水素原子または $R^{\mathfrak{s}} - C_{-}$ ($R^{\mathfrak{s}}$ は $C_{1} \sim C_{\mathfrak{s}}$ のアルキル基を表す)である請求項 1 記載の化合物。

25 26. nが0である請求項25記載の化合物。

27.
$$R^{1}$$
 NR^{8} $-C^{-}$, R^{8} $-O^{-}$, R^{8} $-S^{-}$ $-S^{-}$ $-S^{-}$ $-S^{-}$ $-S^{-}$

 C_s のアルキル基で置換されていてもよいフェニル基で置換された C_1 ~ C_s のアルキル基;または C_1 ~ C_s のアルキル基から選ばれる1以上の置換基を有していてもよいフェニル基を表す)であり、 R^4 および R^6 が水素原子であり、 R^5 が C_1 ~ C_s のアルキル基であり、 R^7 が水素原子

または R° -C $-(R^{\circ}$ は C_{1} \sim C_{\circ} のアルキル基を表す)であり、A が 10 メチル基を有していてもよいエチレン基であり、n が 0 である請求項 1 記載の化合物。

$$H_3$$
 C H_3 C H_3 C H_3 C H_4 C H_5
20 H₃ C であり、R⁴ およびR⁶ が水素原子であり、R⁵ が

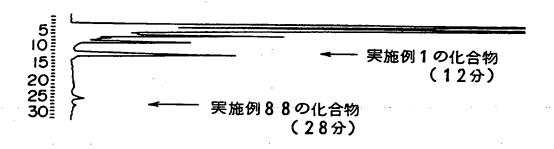
25 $C_1 \sim C_6$ のアルキル基であり、 R^7 が水素原子または $R^8 - C - (R^8)$ は $C_1 \sim C_6$ のアルキル基を表す)であり、A がメチル基を有していても

よいエチレン基であり、nが0である請求項1記載の化合物。

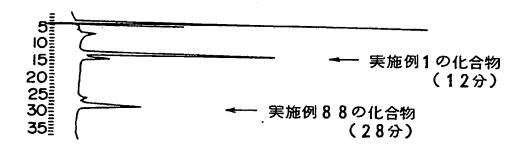
- 29. 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有してなる医薬組成物。
- 30. 請求項1記載の化合物および薬学的に許容される担体を含有して なるシステインプロテアーゼの異常昂進に起因する疾患のための医薬組成 物。

1/1

第 | 図



第 2 図



INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

A. CI	ASSIECATION OF CO		PCT/JP96/00286
Int	ASSIFICATION OF SUBJECT MATTER C16 C07D305/08 307/2	200/11	
	31/34, 31/35, 31/3	2, 309/14, CO7H5	/06, 15/18, A61K31/3
According	w international Patent Classification (IPC) or	to both national classification	and IPC
	TO SEAUCITED		41 C
Minimum T n +	documentation searched (classification system folio	wed by classification symbols	
			/06, 15/18, A61K31/33
Documents	tion searched other than minimum documentation t	o the extent that such document	
l			ere meruged in the fields searched
Electronic	ata basa arawka da k		
Cyc	ats base consulted during the international search (ONLINE	name of data base and, where pro	ecticable, search terms used)
~15	AUTINE		
C. DOCU	MENTS CONSIDERED TO BE RELEVAN		
Category*			
	Citation of document, with indication, who	ere appropriate, of the relevant	passages Relevant to claim No.
E	EP, 641800, Al (Takeda, ('homies' = -	selevant to daim No.
,	Ltd.),	memical Industi	es, 1 - 30
	March 8, 1995 (08. 03. 9	5)	
1	Claim & JP, 8-104685, A		
ľ			1
.			
- 1		•	1
.			1
1			
1	•		
- 1			1
1			}
1			
1			
] =			
ruther d	ocuments are listed in the continuation of Box (See patent famil	Vanney
Special can	gories of cited documents:		
GOCKENENT d	efining the general state of the art which is not consider ticular relevance	date and not in conflict	ed after the international filing date or priority with the application but cited to understand
earlier docu	ment but published on or after the international City	the principle of theory	
cited to est	shigh the multipartition on priority claim(s) or which	is considered novel or car	relevance; the claimed invention cannot be anot be considered to involve an inventive t is taken alone
special reas	on (as specified)	"Y" document of particular	
	eferring to an oral disclosure, use, exhibition or other		relevance; the claimed invention cannot be an inventive step when the document is
the priority	iblished prior to the international filing date but later tha fate claimed	being obvious to a perso	on skilled in the art
		"&" document member of th	e same patent family
Annels	al completion of the international search	Date of mailing of the intern	national search report
ADril	24, 1996 (24. 04. 96)		(14. 05. 96)
F- - -		1 71 1330	(44. 05. 96)
	op address of the 10 A /		· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·
e and mailir	ng address of the ISA/	Authorized officer	
e and mailir	ng address of the ISA/ se Patent Office		

A. 発明の属する分野の分類(国際特許分類(IPC))

Int. C1' C07D305/08, 307/22, 309/14, C07H5/06, 15/18, A61K31/335, 31/34, 31/35, 31/70

B. 調査を行った分野

調査を行った最小限資料(国際特許分類(IPC))

Int. C1° C07D305/08, 307/22, 309/14, C07H5/06, 15/18, A61K31/335, 31/34, 31/35, 31/70

最小限資料以外の資料で調査を行った分野に含まれるもの

国際調査で使用した電子データベース(データベースの名称、調査に使用した用語)

CAS ONLINE

C. 関連する	ると認められる文献	
引用文献の カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連するときは、その関連する箇所の表示	関連する 請求の範囲の番号
E	EP、641800、A1 (Takeda Chemical Industries, Ltd.) 8. 3月. 19 95 (08. 03. 95) 請求の範囲 &JP、8-104685、A	1 - 3 0

□ C欄の続きにも文献が列挙されている。

□ パテントファミリーに関する別紙を参照。

- * 引用文献のカテゴリー
- 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示す もの
- 「E」先行文献ではあるが、国際出願日以後に公表されたもの
- 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行 日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する 文献(理由を付す)
- 「〇」口頭による開示、使用、展示等に督及する文献
- 「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願

- の日の後に公表された文献
- 「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明 の新規性又は進歩性がないと考えられるもの
- 「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以 上の文献との、当業者にとって自明である組合せに よって進歩性がないと考えられるもの
- 「&」同一パテントファミリー文献

####